(19) 世界知的所有権機関 国際事務局

SAIPO OMPI

- 1 CORTA (CORTA) IN CORTA (CORTA CORTA CORT

(43) 国際公開日 2001 年3 月29 日 (29.03.2001)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 01/21576 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07C 233/83, 237/22, 251/38, 317/28, 323/12, 323/41, C07D 213/75, 213/81, 213/82, 239/28, A01N 37/22, 37/50, 43/40

(21) 国際出願番号:

PCT/JP00/06514

(22) 国際出願日:

2000年9月22日(22.09.2000)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特顯平11/270582 1999年9月24日(24.09.1999) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本農 薬株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒103-8236 東京都中央区日本橋1丁目2番5号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 遠西正範 (TOHNISHI, Masanori) [JP/JP]; 〒599-8123 大阪府 堺市北野田296-1-201 Osaka (JP). 中尾勇美 (NAKAO, Hayami) [JP/JP]; 〒586-0001 大阪府河内長野市木戸町 473-6-902 Osaka (JP). 河野栄司 (KOHNO, Eiji) [JP/JP]; 〒494-0013 愛知県尾西市玉野字杁ノ戸48-1 Aichi (JP). 西田立樹 (NISHIDA, Tateki) [JP/JP]; 〒584-0036 大阪府富田林市甲田3丁目7-22-202 Osaka (JP). 古谷敬 (FURUYA, Takashi) [JP/JP]; 〒598-0021 大阪府泉佐野市日根野2821 Osaka (JP). 清水寿明 (SHIMIZU, Toshiaki) [JP/JP]; 〒586-0001 大阪府河内長野市木

戸町974-90-303 Osaka (JP). 瀬尾 明 (SEO, Akira)

[JP/JP]; 〒648-0092 和歌山県橋本市紀見ヶ丘2丁目3番19号 Wakayama (JP). 坂田和之 (SAKATA, Kazuyuki) [JP/JP]; 〒586-0022 大阪府河内長野市本多町5-6-301 Osaka (JP). 藤岡伸祐 (FUJIOKA, Shinsuke) [JP/JP]; 〒586-0024 大阪府河内長野市西之山町1-28 Osaka (JP). 菅野英夫 (KANNO, Hideo) [JP/JP]; 〒567-0832 大阪府茨木市白川3丁目2番2-708 Osaka (JP).

- (74) 代理人: 浅村 皓、外(ASAMURA, Kiyoshi et al.); 〒 100-0004 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 新大手町ビル331 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.
- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

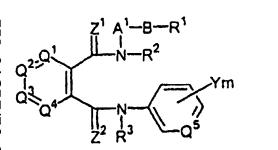
-- 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: AROMATIC DIAMIDE DERIVATIVES OR SALTS THEREOF, AGRICULTURAL/HORTICULTURAL CHEMICALS AND METHOD OF USING THE SAME

(I)

(54) 発明の名称: 芳香族ジアミド誘導体又はその塩類及び農園芸用薬剤並びにその使用方法



(57) Abstract: Aromatic diamide derivatives represented by general formula (I) or salts thereof and agricultural/horticultural chemicals containing the same as the active ingredient, wherein A¹ represents alkylene, alkenylene or alkynylene; B represents, CO-or -C(=N-OR⁴)- (wherein R⁴ represents H, etc.); R¹ to R³ represent each H, etc.; Q¹ to Q⁵ represent each N or carbon; Y represents halogeno, etc.; m is from 0 to 5; and Z¹ and Z² represent each O or S.

/続葉有/

(57) 要約:

本発明は、一般式(I):

$$Q^{2}$$
 Q^{1}
 Q^{1}
 Q^{2}
 Q^{1}
 Q^{2}
 Q^{1}
 Q^{2}
 Q^{3}
 Q^{4}
 Q^{5}
 Q^{5}
 Q^{5}
 Q^{5}
 Q^{5}

{式中、 A^1 はアルキレン、アルケニレン、アルキニレン基;Bは-CO-又は-C(=N-OR⁴)-(式中、 R^4 はH等); $R^1 \sim R^3$ は H等; $Q^1 \sim Q^5$ はN又は炭素原子; Yはハロゲン等;mは $O \sim 5$; Z^1 、 Z^2 はO、S}

で表される芳香族ジアミド誘導体又はその塩類、及び該化合物又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用薬剤並びにその使用方法に関する。

明 細 書

芳香族ジアミド誘導体又はその塩類及び農園芸用薬剤並びにその使用方法

5 技術分野

本発明は芳香族ジアミド誘導体又はその塩類及び該化合物又はその塩類を有効 成分として含有する農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関 するものである。

背景技術

10 EPC公開第919542A2号公報に本発明の一般式(I) で表される芳香族 ジアミド誘導体に類似した化合物が開示されている。

発明の開示

本発明者等は新規な農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤を開発すべく鋭意研究 を重ねた結果、本発明の一般式(I) で表される芳香族ジアミド誘導体又はその塩 15 類は文献未記載の新規化合物であり、農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤として 有用な化合物であることを見いだし、本発明を完成させたものである。

本発明は、一般式(I):

20
$$Q^{2} \stackrel{\text{Z}^{1}}{\underset{\text{Z}^{2}}{\text{R}^{3}}} \stackrel{\text{A}^{1}-\text{B}-\text{R}^{1}}{\underset{\text{Z}^{2}}{\text{R}^{3}}}$$
 (I)

(式中、 A^1 は(C_1 - C_8)アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ 基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_1 - C_6)アルコキン基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルカフィニル基、(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、(C_1 - C_6)アルキルチンルホニル基、(C_1 - C_6)アルキルチンルホニル基、(C_1 - C_6)アルキルチンルボニル基又はフェニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換(C_1 -

WO 01/21576

 C_8)アルキレン基、 (C_3-C_8) アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルボニル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基又はフェニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換 (C_3-C_8) アルケニレン基、 (C_3-C_8) アルキニレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、

10 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ 基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基又はフェニル基から選択される 1 以上の置換 15 基を有する置換 (C_3-C_8) アルキニレン基を示す。

又、前記(C_1 - C_8)アルキレン基、置換(C_1 - C_8)アルキレン基、(C_3 - C_8)アルケニレン基、置換(C_3 - C_8)アルケニレン基、(C_3 - C_8)アルキニレン基又は置換(C_3 - C_8)アルキニレン基中の任意の飽和炭素原子は(C_2 - C_5)アルキレン基で置換されて(C_3 - C_6)シクロアルカン環を示すこともでき、前記(C_1 - C_8)アルキレン基、置換(C_3 - C_8)アルケニレン基、置換(C_3 - C_8)アルケニレン基、置換(C_3 - C_8)アルケニレン基中の任意の 2 個の炭素原子はアルキレン基又はアルケニレン基と一緒になって(C_3 - C_6)シクロアルカン環又は(C_3 - C_6)シクロアルケン環を示すこともできる。

Bは-CO-又は-C($=N-OR^4$)-(式中、 R^4 は水素原子、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ(C_1-C_6)アルキル基、(C_3-C_6)アルケニル基、ハロ(C_3-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、フェニル(C_1-C_4)アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ(C_1-C_6)アルキル基、ハロ(C_1-C_6)アルキシ基、ハロ(C_1-C_6)アルキシ基、ハロ(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハ

 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、ハ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、モノ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基又は $\Gamma(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基から選択される $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキル基を示す。)を示す。

 R^{1} は水素原子、 $(C_{1}-C_{6})$ アルキル基、ハロ $(C_{1}-C_{6})$ アルキル基、 $(C_{2}-C_{6})$ C_6)アルケニル基、ハロ (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、 ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アル 10 コキシ基、 (C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆)アルキルチオ基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルア ミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニト ロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁-C₆)アルコキシ 基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) ア ルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルス 15 ルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスル ホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても 20 良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁- C_6)アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフ ィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホ ニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ 25 基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アル コキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル アミノ基、フェニルオキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ 基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) ア ルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ

 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) ア ルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良 いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選 5 択される1以上の置換基を有する置換フェニルオキシ基、フェニルチオ基、同一 又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル 基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコ キシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シ アノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) 15 C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハ ロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) C_6)アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても 良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から 選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。又、 R^1 は A^1 と結合 20 して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子によ り中断されても良い4~7員環を形成することができる。

 R^2 及び R^3 は同一又は異なっても良く、水素原子、(C_3 - C_6)シクロアルキル基、 $-A^2$ - R^5 (式中、 A^2 は-C(=O) -、-C(=S)-、-C(=N R^6)-(式中、 R^6 は水素原子、(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル

キシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルカニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。)、 (C_1-C_8) アルキレン基、ハロ (C_1-C_8) アルキレン基、ハロ (C_3-C_6) アルキニレン基、ハロ (C_3-C_6) アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6) アルキニレン基を示し、

(1) A^2 が-C (=O) -、-C (=S) -又は-C (=NR⁶) - (式中、 10 R^6 は前記に同じ。)を示す場合、 R^5 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハ ロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、 ハロ (C₃-C₆)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロ ゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキ ル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキ ルチオ基、ハロ (C₁-C₆)アルキルチオ基、 (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、 Λ 口 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハ ロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又 は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカル ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同 20 一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキ ル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アル コキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) 25 C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基 又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する 置換複素環基又は $-A^3-R^7$ (式中、 A^3 は-O-、-S-又は-N (R^8) -(式中、 R^8 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アル

キルカルボニル基、 (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、フェニルカルボニル基、

同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アル キル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) ア ルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) (C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) 5 C_6)アルキルスルホニル基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル基、モノ $(C_1 - C_6)$ C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基 又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する 置換フェニルカルボニル基、フェニル (C₁-C₄)アルコキシカルボニル基又は同 一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)ア 10 ルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルア ミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を 15 環上に有する置換フェニル (C₁-C₄)アルコキシカルボニル基を示す。)を示し、 R^{7} は (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_3-C_6) アルケニル 基、ハロ(C₃-C₆)アルケニル基、(C₃-C₆)アルキニル基、ハロ(C₃-C₆)アル キニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、

20 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル (C_1-C_6) アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、

(2) A^2 が (C_1-C_8) アルキレン基、ハロ (C_1-C_8) アルキレン基、 (C_3-C_6) アルケニレン基、ハロ (C_3-C_6) アルケニレン基、 (C_3-C_6) アルキニレン基又 はハロ(C₃-C₆)アルキニレン基を示す場合、R⁵は水素原子、ハロゲン原子、 シアノ基、ニトロ基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアル キル基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても 20 良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) C_6)アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフ ィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホ ニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ 25 基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アル コキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複 素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C1- C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ

 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^4-R^9$ (式中、 A^4 は-O-、-S-、-S O-、 $-SO_2-$ 、-N (R^8) - (式中、 R^8 は前記に同じ。)、-C (=O) - 又は-C $(=NOR^4)$ - (式中、 R^4 は前記に同じ。)を示し、

- (i) A^4 が-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2$ -又は-N (R^8) (式中、
- 10 R^8 は前記に同じ。)を示す場合、 R^9 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_3-C_6) アルケニル基、ハロ (C_3-C_6) アルキニル基、ハロ (C_3-C_6) アルキニル基、ハロ (C_3-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、フェ
- 15 ニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、
- 20 モノ $(C_1 C_6)$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $(C_1 C_6)$ アルキルアミノ基又は $(C_1 C_6)$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル $(C_1 C_4)$ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $(C_1 C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1 C_6)$ アルキル基、 $(C_1 C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1 C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1 C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1 C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1 C_6)$ アルコキシ
- 25 $-C_6$)アルキルチオ基、ハロ(C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ(C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1-C_6)アルキルアミノ基又は(C_1-C_6)アルキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニ

ル (C_1-C_4) アルキル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルメルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

(ii) A^4 が-C (=O) - 又は-C $(=N-OR^4)$ - (式中、 R^4 は前記に同じ。)を示す場合、 R^9 は水素原子、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_2 - C_6)アルケニル基、ハロ(C_2 - C_6)アルケニル基、(C_3 - C_6)シクロアルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 -

- 15 C_6)アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、テノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても
 - アルキルスルホニル基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1 - C_6)アル

キルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アル

キルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基又は(C₁

-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置

換フェニルアミノ基、フェニルオキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原 子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ 基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は 異なっても良いジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ基又は $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボ ニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルオキシ基、フェニル チオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C1-10 C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチ オ基、 (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニ ル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキ 15 ルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換 基を環上に有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良 く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁- C_6)アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフ ィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホ 20 ニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ 基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アル コキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示 す。)を示す。〕を示す。

25 又、 R^2 は A^1 又は R^1 と結合して、 $1\sim 2$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $4\sim 7$ 員環を形成することができる。

 $Q^1 \sim Q^4$ は同一又は異なっても良く、窒素原子又はX(Xは後記に示す。) で置換されても良い炭素原子を示し、Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原 子、シアノ基、ニトロ基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、

- (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ((C_1-C_6) アルキルチオ基、((C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ((C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、((C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ((C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ((C_1-C_6) アルキルアミノ基又は((C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニ
- 10 ル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $(C_1\text{-}C_6) アルキル基、ハロ \ (C_1\text{-}C_6) アルキル基、 \ (C_1\text{-}C_6) アルコキシ基、ハロ \ (C_1\text{-}C_6) アルコキシ基、 \ (C_1\text{-}C_6) アルキルチオ基、ハロ \ (C_1\text{-}C_6) アルキルチオ基、ハロ \ (C_1\text{-}C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ \ (C_1\text{-}C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ \ (C_1\text{-}C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ \ (C_1\text{-}C_6) アルキルスルホニル$
- 基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^5$ - R^{10} 〔式中、 A^5 は-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2$ -、-C(=O) -、-C(= NOR^4) (式中、 R^4 は前記に同じ。)、(C_1 - C_6)アルキレン基、ハロ(C_1 - C_6)アルキレン基、(C_2 -
- 20 C_6)アルケニレン基、ハロ (C_2-C_6) アルケニレン基、 (C_2-C_6) アルキニレン基 又はハロ (C_3-C_6) アルキニレン基を示し、
 - (1) A^5 が-O-、-S-、-SO-又は $-SO_2-$ を示す場合、 R^{10} はハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルケニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6)
- 25 アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルア

ミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を 有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シ アノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハ 5 $D(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハ $D(C_1-C_6)$ C_6)アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても 良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から 選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^6-R^{11}$ (式中、 A^6 10 は (C_1-C_6) アルキレン基、ハロ (C_1-C_6) アルキレン基、 (C_3-C_6) アルケニレ ン基、ハロ (C_3-C_6) アルケニレン基、 (C_3-C_6) アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6) C_6)アルキニレン基を示し、 R^{11} は水素原子、ハロゲン原子、 (C_3-C_6) シクロ アルキル基、ハロ (C₃-C₆)シクロアルキル基、 (C₁-C₆)アルコキシカルボニ ル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ 15 基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁-C₆)アルコキシ基、 ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキ ルチオ基、 (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフ ィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニ ル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) 20 アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上 の置換基を有する置換フェニル基又は $-A^7-R^{12}$ (式中、 A^7 は-O-、-S-、-SO-又は-SO $_2$ -を示し、 R^{12} は (C_1 - C_6)アルキル基、ハロ (C_1 - $(C_3 - C_6)$ アルキル基、 $(C_3 - C_6)$ アルケニル基、ハロ $(C_3 - C_6)$ アルケニル基、 $(C_3 - C_6)$ C_6)アルキニル基、ハロ (C_3-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、 25 ハロ (C₃-C₆)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロ ゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキ ル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキ ルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、

- (2) A^5 が-C (=O) -又は-C (=NOR 4) (式中、 R^4 は前記に同じ。)を示す場合、 R^{10} は (C_1 - C_6)アルキル基、ハロ (C_1 - C_6)アルキル基、 (C_2 - C_6)アルケニル基、ハロ (C_2 - C_6)アルケニル基、 (C_3 - C_6)シクロアルキ ル基、ハロ (C_3 - C_6)シクロアルキル基、 (C_1 - C_6)アルコキシ基、 (C_1 - C_6)アルキルチオ基、モノ (C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1 - C_6)アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1 - C_6)アルキル基、ハロ (C_1 - C_6)アルキル基、 (C_1 - C_6)アルコキシ基、 (C_1 - C_6)アルキルチオ ストロ (C_1 - C_6)アルコキシ基、 (C_1 - C_6)アルキルチオ ストロ (C_1 - C_6)アルキルチオ (C_1 - C_1
- $(C_1 C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_1 C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1 C_6)$ アルキルスルカスルホニル基、ハロ $(C_1 C_6)$ アルキルスルホニル基、モノ $(C_1 C_6)$ アルキルアミノ基、同一又は 異なっても良いジ $(C_1 C_6)$ アルキルアミノ基又は $(C_1 C_6)$ アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ
- 25 基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1 - C_6)アルキルスルオニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、モノ

(C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルア ミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を 環上に有する置換フェニルアミノ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、 ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) ア 5 ルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) ア ルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニ ル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホニル 基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、 同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキ 10 シカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示し、

(3) A^5 が (C_1 - C_6)アルキレン基、ハロ (C_1 - C_6)アルキレン基、 (C_2 - C_6) アルケニレン基、ハロ (C_2-C_6) アルケニレン基、 (C_2-C_6) アルキニレン基又 はハロ (C_3-C_6) アルキニレン基を示す場合、 R^{10} は水素原子、ハロゲン原子、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アル 15 コキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シ アノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハ μ (C_1 - C_6)アルキルチオ基、 (C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1 - (C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても 良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基又は(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から 選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっ ても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、

25 (C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキル スルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキル スルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキル アミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基又は(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環

基又は $-A^8-R^{13}$ (式中、 A^8 は-O-、-S-、-SO-又は $-SO_2-$ を 示し、 R^{13} は (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハ 5 $D(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハ $D(C_1-C_6)$ アルキル チオ基、 (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィ ニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル 基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)ア ルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の 10 置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン 原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ 基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は 15 異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボ ニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は-A⁹-R¹⁴ (式中、 A^9 は (C_1-C_6) アルキレン基、ハロ (C_1-C_6) アルキレン基、 (C_2-C_6) C_6)アルケニレン基、ハロ (C_2-C_6) アルケニレン基、 (C_2-C_6) アルキニレン基 20 又はハロ (C_3-C_5) アルキニレン基を示し、 R^{14} は水素原子、ハロゲン原子、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アル コキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) C_6)アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキ ルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル 25 スルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコ キシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) (C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキ ルスルフィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル

スルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択さ れる1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なって も良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁ 5 $-C_6$)アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 $(C_1$ $-C_6$)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスル フィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスル ホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミ ノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) ア 10 ルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、 フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハ ロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキル チオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィ 15 ニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル 基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) ア ルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の 置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、 ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) ア ルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) ア ルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニ ル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホニル 基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、 同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキ 25 シカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基を示す。)を示 す。)を示す。〕を示す。

又、芳香環上の隣接した 2 個の X は一緒になって縮合環を形成することができ、 該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、ハ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、ハ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、モノ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基又は $\Gamma(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基から選択される $\Gamma(C_1-C_6)$

 Q^5 は窒素原子又は炭素原子を示し、Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン 原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C₃-C₆)シクロアルキル基、フェニル基、同 一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキ 10 ル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アル コキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1 -C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基 15 又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する 置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコ キシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) C_6)アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキ ルスルフィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル スルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択さ れる1以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^5-R^{10}$ (式中、 A^5 及び R¹⁰は前記に同じ。) を示す。

25 又、芳香環上の隣接した 2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、 該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルチオスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキル

スルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異 なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハ ロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキル 5 スルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキル スルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキル アミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基又は(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニ ル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニ 10 トロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁-C₆)アルコキ シ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル スルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルス ルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $(C_1$ 15 $-C_6$) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基から選択される1以上の置換基を有すること もでき、mは0~5の整数を示す。

Z¹及びZ²は同一又は異なっても良く、酸素原子又は硫黄原子を示す。} で表される芳香族ジアミド誘導体又はその塩類及び農園芸用薬剤、特に農園芸用 殺虫剤並びに該殺虫剤の使用方法に関するものである。

発明を実施するための形態

本発明の一般式(I) で表される芳香族ジアミド誘導体又はその塩類の定義において「ハロゲン原子」とは塩素原子、臭素原子、沃素原子又はフッ素原子を示し、「 (C_1-C_6) アルキル基」とは、例えばメチル、エチル、n-プロピル、i-プ25 ロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-ペンチルを示し、n-ペンチルを示し、n-ペンチルを示し、n-ペンチルを示し、n-ペンチル・アルキルン基」はメチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、n-ペンチルン、n-ペンチルン、n-ペンチルン、n-ペンチルとの点に、n-ペンチルとの点に、n-ペンチルを示し、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチルを示し、n-ペン・n-ペンチルを示し、n-ペン・n-

ジメチルメチレン、テトラメチレン、イソブチレン、ジメチルエチレン、オクタ メチレン等の直鎖又は分枝状の炭素原子数1~8個のアルキレン基を示す。

19

「 (C_3-C_6) シクロアルキル基」とは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の炭素原子3~6個の脂環式のアルキル基を示す。

 Σ 、「 \mathbb{R}^1 は \mathbb{A}^1 と、又は \mathbb{R}^2 は \mathbb{A}^1 と結合して、 $1\sim 2$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $4\sim 7$ 員環」としては、例えばシクロブタン環、シクロペンタン環、シクロヘキサン環、アゼチジン環、ピロリジン環、ピロリン環、ピペリジン環、イミダブリジン環、イミ

ダゾリン環、オキサゾリジン環、チアゾリジン環、イソキサゾリジン環、イソチ

- 10 アゾリジン環、テトラヒドロピリジン環、ピペラジン環、モルホリン環、チオモルホリン環、ジオキサジン環、ジチアジン環等を例示することができ、「 R^2 は R^1 と結合して、 $1\sim 2$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い4~7 員環」としては、例えばアゼチジン環、ピロリジン環、ピロリン環、ピペリジン環、イミダゾリジス環、イミダゾリン環、
- 15 オキサゾリジン環、チアゾリジン環、イソキサゾリジン環、イソチアゾリジン環、 テトラヒドロピリジン環、ピペラジン環、モルホリン環、チオモルホリン環、ジ オキサジン環、ジチアジン環等を例示することがでる。

「複素環基」としては、例えばピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフリル基、チエニル基、テトラヒドロチエ 20 ニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロチオピラニル基、オキサゾリル 基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピラゾリル基等を例示することができ、「縮合環」としては、例えばナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、インダン、キノリン、キナゾリン、インドール、インドリン、クロマン、イソクロマン、ベングジオキサン、ベングジオキソール、ベングフラン、ジヒドロベングフラン、ベングチオフェン、ジヒドロベングチオフェン、ベングオキサゾール、ベングチアゾール、ベンズイミダゾール、インダゾール等を例示することができる。

「塩類」としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、燐酸塩等の無機酸塩類、

WO 01/21576 PCT/JP00/06514

酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩等の有機酸塩類、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン等の金属イオン等との塩類を例示することができる。

5 本発明の一般式(I)で表される芳香族ジアミド誘導体又はその塩類は、その構造式中に1つ又は複数個の不斉炭素原子又は不斉中心を含む場合があり、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式(I)で表される芳香族ジアミド誘導体又はその塩類は、その構造式中に炭素一炭素二重結合又は炭素一窒素二重結合に由来する2種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

本発明の一般式(I) で表される芳香族ジアミド誘導体又はその塩類の好ましい態様としては、 A^1 は(C_1 - C_4)アルキレン基、(C_3 - C_5)アルケニレン基又は $(C_3$ - C_5)アルキニレン基を示し、Bは一C O - C (= N - O R^4) - (式中、 R^4 は水素原子又は(C_1 - C_3)アルキル基を示す。)を示し、 R^1 は(C_1 - C_3)アルキル基、(C_1 - C_3)アルコキシ基、モノ(C_1 - C_3)アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ(C_1 - C_3)アルキルアミノ基を示し、 R^2 及び R^3 は水素原子を示し、 Q^1 及び Q^2 は炭素原子を示し、Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基を示し、 Q^3 及び Q^4 は炭素原子を示し、 Q^5 は窒素原子又は炭素原子を示し、Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1 - C_6)アルコキシ基を示し、X0、X1、X1、X2 以前一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(X3 によっている。X4 によっている。X5 になっている。X5 になっている。X6 になっている。X7 になっている。X8 になっている。X9 になっている。X9 になっている。X1 になっている。X2 になっている。X3 になっている。X3 になっている。X4 になっている。X5 になっている。X5 になっている。X6 になっている。X7 になっている。X8 になっている。X9 になっている。X9 になっている。X9 になっている。X1 になっている。X2 になっている。X3 になっている。X3 になっている。X4 になっている。X5 になっている。X5 になっている。X5 になっている。X6 になっている。X7 になっている。X9 になっている。X9 になっている。X1 になっている。X2 になっている。X3 になっている。X4 になっている。X5 になっている。X5 になっている。X5 になっている。X5 になっている。X6 になっている。X7 になっている。X9 になっている。X9 になっている。X1 になっている。X1 になっている。X2 になっている。X3 になっている。X4 になっている。X5 になっ

本発明の一般式(I) で表される芳香族ジアミド誘導体又はその塩類は、例えば 下記に図示する製造方法により製造することができるが、本発明は特願平10-350768号に開示の方法等でも製造でき、これらに限定されるものではない。

導体又はその塩類である。

製造方法1.

(式中、 R^1 、 R^2 、 A^1 、B、 $Q^1 \sim Q^5$ 、Y、m、 Z^1 及び Z^2 は前記に同じ。)

10 一般式(II)で表される無水カルボン酸誘導体と一般式(III)で表されるアミン類とを不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(IV)で表されるイミド誘導体とし、該イミド誘導体(IV)を単離し又は単離せずして一般式(V)で表されるアミン類と反応させることにより、一般式(I)で表される芳香族ジアミド誘導体を製造することができる。

15 (1). 一般式(II)→一般式(IV)

20

0

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の塩素化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、酢酸等の酸類、ジメチルスルホキシド、1、3ージメチルー2ーイミダゾリジノン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

25 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれ かの反応剤を過剰に使用することもできる。本反応は必要に応じて脱水条件下で 反応を行うこともできる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応 時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適 WO 01/21576 PCT/JP00/06514

宜選択すれば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。又、反応系から目的物を単離せずに次の反応工程に供することも可能である。

一般式(II)で表される無水カルボン酸誘導体は J. Org. Chem., <u>52</u>, 129 (1987)、J. Am. Chem. Soc., <u>51</u>, 1865 (1929)、同, <u>63</u>, 1542 (1941)等に記載の方法により製造することができ、一般式(III)で表されるアミン類は J. Org. Chem., <u>29</u>, 1 (1964)、Angew. Chem. Int. Ed. Engl., <u>24</u>, 871 (1985)、Synthesis, <u>1984</u>, 667、日本化学会誌, <u>1973</u>, 2351、DE-2606982号公報、特開平1-90163号公報等に記載の方法により製造することができる。又、一般式(V)で表されるアミン類はChem. Pharm. Bull., 30(5), 1921-1924 (1982)、実験化学講座22 有機合成IV(アミノ酸、ペプチド)(1992)等に記載の方法により製造することができる。

(2). 一般式(IV)→一般式(I)

本反応で使用できる不活性溶媒は(1)で使用できる不活性溶媒を例示することができる。

20 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、一般式 (V) で表されるアミン類を過剰に使用することもできる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適 宜選択すれば良い。

25 反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

(111-1)

$$\begin{array}{c} A^{1}-B-R^{1} \\ HN-R^{2} \\ (V) \end{array}$$

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 A^1 、B、 Q^1 ~ Q^5 、Y及びmは前記に同じ。)

一般式(II-1)で表されるカルボン酸無水物誘導体と一般式(V)で表されるアミン類とを不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(VI-2)で表されるカルボン酸アミド類とし、該カルボン酸アミド類(VI-2)を単離し又は単離せずして、R²が水素原子を示すカルボン酸アミド類(VI-2)の場合、縮合剤の存在下に縮合反応を行い、一般式(VII-2)で表される化合物とし、該化合物(VII-2)を単離し又は単離せずして、不活性溶媒の存在下に一般式(III-1)で表されるアミン類と反応させ、カルボン酸アミド(VI-2)のR²が水素原子以外を示すカルボン酸アミド類(VI-2)の場合、一般式(III-1)で表されるアミン類と縮合剤の存在下に縮合させることにより、一般式(III-1)で表される芳香族ジアミド誘導体を製造することができる。

又は一般式(II-1)で表されるカルボン酸無水物誘導体と一般式(III-1)で表されるアミン類とを不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(VI-1)で 表されるカルボン酸アミド類とし、該カルボン酸アミド類(VI-1)を単離し又は単離せずして、R³が水素原子を示すカルボン酸アミド類(VI-1)の場合、縮合剤の存在下に縮合反応を行い、一般式(VII-1)で表される化合物とし、該化合物(VII-1)を単離し又は単離せずして、不活性溶媒の存在下に一般式(V)で表されるアミン類と反応させ、R³が水素原子以外のカルボン酸アミド類(VI-1)の場 合、一般式(V)で表されるアミン類と縮合剤の存在下に縮合させることにより一般式(I-2)で表される芳香族ジアミド誘導体を製造することができる。

- (1). 一般式(II-1)→一般式(VI-1)又は一般式(II-1)→一般式(VI-2) 本反応は製造方法1-(2)と同様にすることにより目的物を製造することができる。
- 25 (2). 一般式(VII-1) 又は一般式(VII-2) →一般式(I-1)
 本反応は製造方法1-(2) と同様にすることにより目的物を製造することができる。
 - (3). 一般式(VI-1)→一般式(VII-1) 又は一般式(VI-2)→一般式(VII-2) 本反応は、J. Med. Chem., 10,982(1967)に記載の方法

に従って目的物を製造することができる。

(4). 一般式(VI-1)又は一般式(VI-2)→一般式(I-1)

一般式(VI-1)又は一般式(VI-2)で表されるカルボン酸アミド誘導体と一般式 (V) 又は一般式(III-1)で表されるアミン類を縮合剤及び不活性溶媒の存在下に 反応させて製造することができる。本反応は必要に応じて塩基の存在下に反応することもできる。

本反応で使用する不活性溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、ジエチル

エーテル、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム等を例示することができる。本反応で使用する縮合剤としては、通常のアミド製造に使用されるものであれ は良く、例えば向山試薬(2-クロローN-メチルピリジニウム アイオダイド)、DCC(1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド)、CDI(カルボニルジイミダゾール)、DEPC(シアノリン酸ジエチル)等を例示することができ、その使用量は、一般式(VI-1)又は一般式(VI-2)で表されるカルボン酸アミド誘導体に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

15 本反応で使用できる塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基類、炭酸カリウム等の無機塩基類を例示することができ、その使用量は一般式(VI-1)又は一般式(VI-2)で表されるカルボン酸アミド誘導体に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

反応温度は0℃乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間 20 は、反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲である。 反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

以下に一般式(I) で表されるフタル酸ジアミド誘導体の代表的な化合物を第1 表及び第2表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。以下の 表において、Meとはメチル基を、Etとはエチル基を、Prとはプロピル基を、 Buとはブチル基を、Phとはフェニル基を、Pyrとはピリジル基を、cーは 脂環式炭化水素基を示し、物性は融点 (℃)を示す。

尚、第1表中、Xが結合する $Q^1 \sim Q^4$ は Q^1 が3位、 Q^2 が4位、 Q^3 が5位、

Q ⁴が 6 位を示すものとする。 一般式(I)

5

$$Q^{2}$$
 Q^{1}
 Q^{2}
 Q^{1}
 Q^{2}
 Q^{3}
 Q^{4}
 Q^{2}
 Q^{3}
 Q^{4}
 Q^{5}
 Q^{5}
(I)

第1表 ($Q^1=Q^2=Q^3=Q^4=C-X$ 、 $Q^5=C$ 、 $Z^1=Z^2=O$ 、 $R^3=H$)

10	No.	-A¹-B-R¹	R²	X	Ym	物性
	1	CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-F	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	120
	2	CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-C1	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	103
	3	CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-Br	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	134
	4	CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	120
15	5	CH(Me)CO₂Et	Н	3-F	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	140
	6	CH(Me)CO₂Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	145
	7	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-F	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	88
	8	$CH_2CH_2CO_2Et$	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	112
	9	CH ₂ CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	133
20	10	CH ₂ CH ₂ CO ₂ Et	Н	6-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	164
	11	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	ペースト

第1表(続き)

No.	-A'-B-R'	R²	X	Ym	物性	
12	CH(Me)CH₂CO₂Me	·H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
13	CH (Me) CH_2CO_2Pr-i	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$		
14	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Bu-t	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$		
15	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	4-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$		
16	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-CF ₃	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$		
17	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-0CF ₃	2-C1-4-CF(CF ₃) ₂		
18	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂		
19	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CH=C(C1)CF}_3$		
20	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	2-Me-4-CH=CBr_2		
21	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$4-C0_2$ CH(CF ₃) ₂		
22	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н	3-I	$2\text{-Me-4-C} \equiv \text{C-}$		
				(2, 4-Cl ₂ -Ph)		
23	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н.	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-C} \equiv \text{C-Bu-t}$		
24	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-CF ₃	2-F-4-CF ₂ CF ₃		
25	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н	3-I	$2\text{-OMe-}4\text{-CF(CF}_3)_2$		
26	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н	3-I	$2\text{-Me}-4\text{-C(CH}_3)=\text{NOMe}$		
27	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$2-Me-4-C(CH_3)=NO-$		
				CH₂-Ph		
28	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н	3-1	3-0CF ₂ CF ₂ 0-4		
29	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	3-0CF ₂ CF ₂ -4		
30	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н	3-I	2-C1-3-0CF ₂ CF ₂ 0-4		
31	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н	3-I	3-0CF ₂ 0-4		
32	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	3-0CHFCF ₂ 0-4		

第1表(続き)

No.	-A'-B-R'	R²	X	Ym	物性
33	CH (Me) CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	3-0CF₂CHF0-4	
34	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃)	2
35	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me}-5\text{-F}-4\text{-CF}(CF_3)$	2
36	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н	3-I	2-Me-4-(4-CF ₃ -Ph)	
37	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	2-Me-4-(4-C1-Ph)	
38	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н	3-I	2-Me-4-(4-C1-Ph0)	
39	CH(Me)CO₂Et	H	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_3$	
40	CH(Me)CO₂Et	Н	3-I	$2\text{-Me}-4\text{-OCF}_2\text{CF}_3$	
41	CH(Me)CO₂Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_3$	
42	CH(Me)CO₂Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}3\text{-CF}_2\text{CF}_3$	
43	CH(Me)CO₂Et	Н	3-I	2-Me-4-SCF ₃	
44	CH(Me)CO₂Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-SOCF}_3$	
45	CH(Me)CO₂Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-SO}_2\text{CF}_3$	
46	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me}\text{-}4\text{-SCF}_2\text{CF}_3$	
47	CH(Me)CO₂Et	Н	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHFOCF	3
48	CH(Me)CO₂Et	H	3-I	2-Me-4-(5-CF ₃ -2-P	yr-0)
49	CH(Me)CO₂Et	Н	3-C1	2-Me-4-(3-C1-5-CF	3
				-2-Pyr-0)	
50	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н	3-NO ₂	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
51	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3, 4-Cl ₂	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
52	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-SCF ₃	$2\text{-Me}\text{-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	
53	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-S0CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
54	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-S0 ₂ CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

第1表 (続き)

No.	-A'-B-R'	R²	X	Ym	物性
55	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н	3-Ph	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
56	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н	3-0Ph	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
57	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-(4-C1-F	PhO) $2-Me-4-CF(CF_3)_2$	
58	CH(Me)CO ₂ Et	Н	3-I	2-Me-4-C1	
59	CH(Me)CO₂Et	Н	3-CONHPr-	-i 2-Me-4-C1	
60	CH(Me)CH₂CO₂Et	Н	3-CH=CH-C	CH=CH-4 2-Me-4-C1	
61	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Me	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
62	CH(Me)CH₂CO₂Et	Et	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
63	$C(Me)_2C \equiv CCO_2Et$	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
64	C(Me) 2CH=CHCO2Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	250
65	CH(CH ₂ SMe)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
66	CH(CF ₃)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
67	CH(CH ₂ OMe)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
68	CH(Ph)CH₂CO₂Et	Н	3-1	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
69	CH(4-C1-Ph)CH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
70	CH (Me) CON (Me) 2	Н	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	122
71	CH(Me)CON(Me) ₂	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	156
72	CH(Me)CON(Et) ₂	Н	3-1	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	133
73	CH(Me)CH₂CONHMe	Н	3-I	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	220
74	CH(Me)CH₂CONHEt	. H	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	208
75	CH(Me)CH₂CON(Me)Ph	Н	3-I	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	200
76	CH(Me)CH ₂ CON(Me) ₂	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	102
77	CH (Me) CH ₂ CON (Me) ₂	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	126

第1表(続き)

No.	-A'-B-R'	R²	Х	Ym	物性
78	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	137
79	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	4-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
80	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-CF ₃	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
81	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-0CF ₃	2-C1-4-CF(CF ₃) ₂	
82	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-I	$2-Et-4-CF(CF_3)_2$	
83	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-I	$2-Me-4-CH=C(C1)CF_3$	
84	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-I	2-Me-4-CH=CBr ₂	
85	CH(Me)CON(Et) ₂	Н	3-I	$4-C0_2$ CH (CF $_3$) $_2$	
86	CH(Me)CON(Et) ₂	Н	3-I	$2\text{-Me-4-C} \equiv \text{C-}$	
				(2, 4-Cl ₂ -Ph)	
87	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-C} \equiv \text{C-Bu-t}$	
88	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-CF ₃	2-F-4-CF ₂ CF ₃	
89	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-I	$2\text{-OMe-4-CF(CF}_3)_2$	
90	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-I	$2-Me-4-C(CH_3)=NOMe$	
91	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-I	$2-Me-4-C(CH_3)=NO-$	
				CH ₂ -Ph	
92	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-I	3-0CF ₂ CF ₂ 0-4	
93	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-I	3-0CF ₂ CF ₂ -4	
94	CH(Me)CON(Et) ₂	Н	3-I	2-C1-3-0CF ₂ CF ₂ 0-4	
95	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-I	3-0CF ₂ 0-4	
96	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-I	3-0CHFCF ₂ 0-4	
97	CH(Me)CON(Et) ₂	Н	3-I	3-0CF ₂ CHF0-4	
98	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-I	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃)	2
	•				

第1表(続き)

	No.	-A¹-B-R¹	R²	X	Ym	物性
	99	CH (Me) CH₂CONHEt	Н	3-I	2-Me-5-F-4-CF(CF	· ₃) ₂
	100	CH (Me) CON (Et) 2	Н	3-I	2-Me-4-(4-CF ₃ -Ph)
5	101	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-I	2-Me-4-(4-Cl-Ph)	
	102	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-I .	2-Me-4-(4-C1-Ph0)
	103	CH(Me)CON(Et) ₂	Н	3-I	2-Me-4-OCF ₃	
	104	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CF ₃	
	105	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-I	2-Me-4-CF ₃	
10	106	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-I	2-Me-3-CF ₂ CF ₃	
	107	CH(Me)CON(Et) ₂	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-SCF}_3$	
	108	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-I	2-Me-4-SOCF ₃	
	109	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-I	2-Me-4-S0 ₂ CF ₃	
	110	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-SCF}_2\text{CF}_3$	
15	111	CH(Me)CON(Et) ₂	Н	3-I	2-Me-4-OCF₂CHFOC	F ₃
	112	$CH(Me)CH_2CON(Et)_2$	Н	3-I	2-Me-4-(5-CF ₃ -2-	Pyr-0)
	113	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-C1	2-Me-4-(3-C1-5-C	F ₃
					-2-Pyr-0)
	114	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-NO ₂	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
20	115	CH(Me)CON(Et) ₂	Н	3, 4-Cl ₂	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
	116	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-SCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	117	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-S0CF ₃	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
	118	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-S0 ₂ CF ₃	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	٠
	119	CH(Me)CON(Et) ₂	Н	3-Ph	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
25	120	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-0Ph	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	

第1表 (続き)

	No.	-A'-B-R'	R²	X		Y	'm	物性
	121	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-(4-C1-P	h0)	2-M	le-4-CF(CF	3) 2
	122	CH(Me)CON(Et) ₂	Н	3-I		2-M	le-4-C1	
5	123	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-CONHPr-	i	2-M	le-4-Cl	
	124	CH(Me)CH₂CONHEt	Н	3-СН=СН-С	н=сн-	-4	2-Me-4-C	l
	125	CH(Me)CON(Et) ₂	Ме	3-I	2-Me	e-4 -	·CF(CF ₃) ₂	
	126	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Et	3-I	2-Me	-4-	·CF(CF ₃) ₂	
	127	$C(Me)_2C \equiv CCON(Et)_2$	Н	3-I	2-Me	-4-	CF(CF ₃) ₂	
10	128	C(Me) ₂ CH=CHCON(Et) ₂	Н	3-I	2-Me	-4-	CF(CF ₃) ₂	
	129	CH(CH ₂ SMe)CH ₂ CON(Et) ₂	Н	3-I	2-Me	-4-	·CF(CF ₃) ₂	
	130	CH(CF₃)CH₂CONHEt	Н	3-I	2-Me	-4-	·CF (CF ₃) ₂	
	131	CH(CH₂OMe)CH₂CONHEt	Н	3-I	2-Me	-4-	CF(CF ₃) ₂	
	132	CH(Ph)CH2CON(Et)2	Н	3-I .	2-Me	-4-	·CF(CF ₃) ₂	
15	133	CH(4-C1-Ph)CH₂CONHEt	Н	3-I	2-Me	e-4-	·CF(CF ₃) ₂	
	134	CH (Me) COMe	Н	3-I	2-Me	-4-	·CF(CF ₃) ₂	189
	135	CH (Me) COPh	Н	3-I	2-Me	-4-	·CF(CF ₃) ₂	171
	136	CH (Me) CH=NOMe	Н	3-I	2-Me	-4-	·CF(CF ₃) ₂	192
	137	CH (Me) CH=NOMe	Н	6-I	2-Me	-4-	CF(CF ₃) ₂	ペースト
20	138	CH (Me) CH=NOCH₂Ph	Н	3-I	2-Me	e-4-	·CF(CF ₃) ₂	ペースト
	139	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3-I	2-Me	-4-	·CF(CF ₃) ₂	126
	140	CH(Me)C(Me)=NOMe	Н	3-I	2-Me	-4-	CF(CF ₃) ₂	107
	141	CH ₂ C(Ph)=NOMe	Н	3-1	2-Me	-4-	·CF (CF ₃) ₂	106
	142	CH(Me)CH=NOMe	Н	4-I	2-Me	-4-	CF (CF ₃) ₂	
25	143	CH(Me)C(Me)=NOMe	Н	3-CF ₃	2-Me	-4-	CF ₂ CF ₃	

第1表 (続き)

No.	-A 1-B-R 1	R²	X	Ym	物性
144	CH (Me) CH=NOMe	Н	3-0CF ₃	2-C1-4-CF(CF ₃) ₂	
145	C(Me) 2CH=NOMe	Н	3-I	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
146	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-CH=C(C1)CF ₃	
147	CH(Me)C(Me)=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-CH=Br ₂	
148	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-I	4-CO ₂ CH(CF ₃) ₂	
149	C(Me) 2CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-C≡C-	
				(2, 4-C1 ₂ -Ph)	
150	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-C} \equiv \text{C-Bu-t}$	
151	CH ₂ C(Me)=NOMe	Н	3-CF ₃	2-F-4-CF ₂ CF ₃	
152	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-}0\text{Me-}4\text{-}CF(CF_3)_2$	
153	C(Me)₂CH=NOMe	Н	3-I	$2-Me-4-C(CH_3)=NOMe$	
154	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-C(CH ₃)=NO-	
				CH ₂ -Ph	
155	CH(Me)C(Me)=NOMe	Н	3-I	3-0CF ₂ CF ₂ 0-4	
156	CH (Me) CH=NOMe	Н	3-I	3-0CF ₂ CF ₂ -4	
157	C(Me) 2CH=NOMe	Н	3-I	2-C1-3-0CF ₂ CF ₂ 0-4	
158	CH(Me)C(Me)=NOMe	Н	3-I	3-0CF ₂ 0-4	
159	CH (Me) CH=NOMe	Н	3-I	3-0CHFCF ₂ 0-4	
160	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3-I	3-0CF ₂ CHF0-4	
161	CH (Me) CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
162	CH(Me)C(Me)=NOMe	Н	3-I	2-Me-5-F-4-CF(CF ₃) ₂	
163	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-(4-CF ₃ -Ph)	
164	C(Me) 2CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-(4-Cl-Ph)	

第1表 (続き)

	No.	-A'-B-R'	R ²	X	Ym	物性
	165	CH (Me) CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-(4-C1-Ph0)	
	166	CH(Me)C(Me)=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-OCF ₃	
5	167	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CF ₃	
	168	C(Me) 2CH=NOMe	Н	. 3 –I	2-Me-4-CF ₃	
	169	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}3\text{-CF}_2\text{CF}_3$	
	170	CH(Me)C(Me)=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-SCF ₃	
	171	CH (Me) CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-SOCF ₃	
10	172	C(Me)₂CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-SO}_2\text{CF}_3$	
	173	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-SCF ₂ CF ₃	
	174	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	
	175	C(Me) 2CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-(5-CF ₃ -2-Pyr	r-0)
	176	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-C1	2-Me-4-(3-C1-5-CF ₃	
15					-2-Pyr-0)	
	177	C(Me)₂CH=NOMe	Н	$3-N0_2$	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	149
	178	CH(Me)CH=NOMe	Н	3, 4-Cl ₂	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	179	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-SCF ₃	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	180	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3-S0CF ₃	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
20	181	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-S0 ₂ CF ₃	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	182	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3-Ph	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	183	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-0Ph	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	184	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-(4-Cl-Ph0	$)) 2-Me-4-CF(CF_3)_2$	
	185	C(Me) 2CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-Cl	
25	186	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-CONHPr-i	2-Me-4-Cl	

第1表 (続き)

					•	
No	•	-A'-B-R'	R²	X	Ym	物性
18	7	CH (Me) CH=NOMe	Н	3-CH=C	CH-CH=CH-4 2-Me-4-C1	
18	8	CH(Me)CH=NOMe	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
18	9	CH (Me) CH=NOMe	Et	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
19	0	CH(CH₂SMe)CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
19	1	CH (CF ₃) CH=NOEt	Н	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
19	2	CH(CH₂OMe)CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
19	3	CH(Ph)CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
19	4	CH(Me)CH₂CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
19	5	CH (Me) CH=NOCH ₂ -	Н	3-I	$2\text{-Me}-4\text{-CF(CF}_3)_2$	
		(4-t-Bu-Ph)				
19	6	CH (Me) CH=NOCH ₂ -	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
		(4-t-BuO ₂ C-Ph)				
19	7	CH(Me)CO ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
19	8	CH(Me)CO ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
19	9	CH (Me) CO ₂ CH ₂ -Ph	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
20	0	CH ₂ CH=CHCO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
20	1	$CH_2C \equiv CCO_2Et$	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
20	2	CH (Me) CH=CHCO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
203	3	CH(Me)C≡CCO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
204	4	CH (Me) CONHEt	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	210
20	5	CH (Me) CONHPr-n	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	201
200	ŝ	CH (Me) CONHPr-c	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
20	7	CH (Me) CONHBu-n	Н	3-I	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	214

第1表 (続き)

	No.	-A'-B-R'	R²	Х	Ym	物性
	208	CH (Me) CONHCH 2 CH=CH2	Н	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	209	$CH(Me)CONHCH_2C \equiv CH$	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	
5	210	CH (Me) CONHCH ₂ CF ₃	Н	3-I	$2-Me-4-CF(CF_3)_2$	
	211	CH (Me) CONHCH ₂ CH ₂ SMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	212	CH(Me)CONHCH2CH2SOMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	213	CH (Me) CONHCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Н	3-I	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
	214	CH (Me) CONHCH2CH2OMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
10	215	CH (Me) CONHCH ₂ -Ph	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	212
	216	CH(Me)CON(n-Pr) ₂	Н	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	142
	217	$CH(Me)CON(CH_2CH_2)_2O$	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	165
	218	$CH(Me)CON(CH_2)_5$	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	170
	219	CH (Me) CON (CH ₂) ₄	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	205
15	220	C(Me)₂CONHEt	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	221	C(Me) 2CONHPr-n	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	
	222	CH (Me) CONHCH2CH=CH2	Н	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	223	$CH(Me)CONHCH_2C \equiv CH$	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	
	224	CH (Me) CH=CHCONHMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
20	225	$CH(Me)C \equiv CCONHEt$	Н	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	226	C(Me) 2CH=CHCONHEt	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	245
	227	$C(Me)_2C \equiv CCONHEt$	Н	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	228	CH(Me)C(=0)H	Н	Н	2-Me-4-OCF ₃	134
	229	C(Me) ₂ C(=0)H	Н	Н	2-Me-4-OCF ₃	150
25	230	$C \text{ (Me) }_{2}C \text{ (=0) H}$	Н	Н	$2-Me-4-OCF_2CHFOC_3F_7-n$	159

第1表(続き)

	No.	-A¹-B-R¹	R²	X		Ym	物性
	231	C (Me) ₂ C (=0) H	Н	Н	2	-Me-4-OCF ₂ CHFCF ₃	171
	232	$C \text{ (Me) }_{2}C \text{ (=0) H}$	Н	Н	2	2-Me-4-0-(3-C1-5-CF ₃ -	159
5						2-Pyr)	
	233	$C (Me) _{2}C (=0) H$	Н	Н		2-Me-4-C1	229
	234	$C(Me)_{2}C(=0)H$	Н	Н		2-Me-4-CF ₂ CF ₃	87
	235	$C(Me)_{2}C(=0)H$	Н	Н		2-Me-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃	143
	236	$C \text{ (Me) }_{2}C \text{ (=0) H}$	Н	Н		$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	214
10	237	$C (Me)_2 C (=0) H$	Н	3-NO ₂		$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	262
	238	$C(Me)_{2}C(=0)H$	Н	3-F		$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	146
	239	$C(Me)_{2}C(=0)H$	Н	3, 4-Cl ₂		$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	166
	240	$(CH_2)_2C(=0)H$	Н	3-I		$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	128
	241	$CH(CH_2SO_2Me)C(=0)H$	Н	3-I		$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	106
15	242	C(Me) (CH2SO2Me) C (=0) H	Н	3-I		$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	118
	243	C(Me) (CH2SO2Et)C(=0)H	Н	3-I		$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	103
	244	C(Me) ₂CH=NOH	Н	Н		2-Me-4-OCF ₂ CHFCF ₃	150
	245	C(Me) 2CH=NOH	Н	Н		2-Me-4-OCF ₂ CF ₃	182
	246	C (Me) ₂ CH=NOH	Н	3-I		2-Me-4-OCF ₂ CF ₃	189
20	247	C (Me) 2CH=NOH	Н	3-F		$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	242
	248	C (Me) ₂ CH=NOH	Н	3-I		$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	218
	249	C(Me) (CH ₂ SO ₂ Me) CH=NOH	Н	3-I		$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	106
	250	C(Me) (CH ₂ SO ₂ Et) CH=NOH	Н	3-I		$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	112
	251	CH₂CH=NOMe	Me	Н		$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	127
25	252	CH (Me) CH=NOMe	Н	Н		2-Me-4-OCF ₃	133

第1表 (続き)

	No.	-A¹-B-R¹	R²	X	Ym	物性
	253	CH (Me) CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-OCF ₃	159
	254	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-Br	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_3$	168
5	255	CH(Me)CH=NOMe	Н	Н	$2-Me-4-CF_2CF_3$	130
	256	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-I	$2-Me-4-CF_2CF_3$	110
	257	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-C1	$2-Me-4-CF_2CF_3$	154
	258	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-Br	$2-Me-4-CF_2CF_3$	162
	259	CH(Me)CH=NOMe	Н	Н	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	154
10	260	CH(Me)CH=NOMe	Н	3-0CF ₃	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	165
	261	C(Me) 2CH=NOMe	Н	Н	$2\text{-Me-}4\text{-OCHF}_2$	170
	262	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-OCHF}_2$	184
						(E体)
	263	C(Me) ₂CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-Me}\text{-}4\text{-}0\text{CHF}_2$	182
15						(Z体)
	264	C(Me) 2CH=NOMe	H	Н	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_3$	195
	265	C(Me) 2CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_3$	191
	266	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3-C1	2-Me-4-OCF ₃	199
	267	C(Me) 2CH=NOMe	Н	3-Br	$2\text{-Me-}4\text{-}0\text{CF}_3$	184
20	268	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3, 4-C1 ₂	2-Me-4-OCF ₃	212
	269	C(Me) 2CH=NOMe	Н	Н	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_2\text{CHF}_2$	174
	270	C(Me) 2CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-}0\text{CF}_{2}\text{CHF}_{2}$	185
	271	C(Me) 2CH=NOMe	Н	Н	2-Me-4-OCF ₂ CHFCF ₃	160
	272	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	Н	2-Me-4-OCF ₂ CHFOC ₃ F ₇ -n	140

25

第1表 (続き)

	-A¹-B-R¹ C (Me) ₂ CH=NOMe C (Me) ₂ CH=NOMe	R ² H H H H		Ym -Me-4-0-(3-C1-5-CF ₃ - 2-Pyr) 2-Me-4-C1 2-Me-4-CF ₂ CF ₃ 2-Me-4-CF ₂ CF ₃ 2-Me-4-CF ₂ CF ₃	物性 151 178 200 225 147
<u>.</u>	C (Me) ₂ CH=NOMe	н н н н	H H 3-I-4-C1 3-I	$2-Pyr$) $2-Me-4-C1$ $2-Me-4-CF_2CF_3$ $2-Me-4-CF_2CF_3$ $2-Me-4-CF_2CF_3$	178 200 225
; ;	C (Me) ₂ CH=NOMe	н н н	H 3-I-4-C1 3-I	$2-Me-4-C1$ $2-Me-4-CF_2CF_3$ $2-Me-4-CF_2CF_3$ $2-Me-4-CF_2CF_3$	200 225
; ;	C (Me) ₂ CH=NOMe	н н н	H 3-I-4-C1 3-I	$2-Me-4-CF_2CF_3$ $2-Me-4-CF_2CF_3$ $2-Me-4-CF_2CF_3$	200 225
	C (Me) ₂ CH=NOMe C (Me) ₂ CH=NOMe C (Me) ₂ CH=NOMe C (Me) ₂ CH=NOMe	Н Н Н	3-I-4-C1 3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃ 2-Me-4-CF ₂ CF ₃	225
·	C (Me) ₂ CH=NOMe C (Me) ₂ CH=NOMe C (Me) ₂ CH=NOMe	H	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1	C (Me) ₂ CH=NOMe C (Me) ₂ CH=NOMe	Н			147
)	C(Me) ₂ CH=NOMe		3-C1	2-Me-4-CFCF-	
		Н		2 mc 1 OI 201 3	202
)	C(Me) ₂ CH=NOMe		3-Br	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	207
	2 ()	Н	Н	2-Me-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃	174
	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	Н	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	178
	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	4-CF ₃	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	155
	C(Me)₂CH=NOMe	Н	3-0CF ₃	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	186
	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3-F	$2-Me-4-CF(CF_3)_2$	199
	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3-C1	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	234
ı	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3-Br	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	243
	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3, 4-C1 ₂	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	207
	C(Me)₂CH=NOMe	Н	Н	2-C1-4-CF ₃	154
	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3-I	2-C1-4-CF ₃	167
	C(Me)₂CH=NOEt	Н	Н	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	157
	C(Me)₂CH=NOEt	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	119
	CH (Me) CH=NOPr-n	Н	Н	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	172
	CH(Me)CH=NOCH2Pr-c	Н	Н	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	91
	CH (Me) CH=NOCH ₂ CH ₂ SEt	Н	Н	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	ペース
		Н	Н	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	ペース
		CH (Me) CH=NOPr-n CH (Me) CH=NOCH ₂ Pr-c	CH (Me) CH=NOPr-n H CH (Me) CH=NOCH ₂ Pr-c H CH (Me) CH=NOCH ₂ CH ₂ SEt H	CH (Me) CH=NOPr-n H H CH (Me) CH=NOCH ₂ Pr-c H H CH (Me) CH=NOCH ₂ CH ₂ SEt H H	CH (Me) CH=NOPr-n H H $2\text{-Me}-4\text{-CF}$ (CF ₃) $_2$ CH (Me) CH=NOCH ₂ Pr-c H H $2\text{-Me}-4\text{-CF}_2$ CF ₃ CH (Me) CH=NOCH ₂ CH ₂ SEt H H $2\text{-Me}-4\text{-CF}_2$ CF ₃

第1表 (続き)

No.	-A 1-B-R 1	R² X		Ym	物性
296	CH (Me) CH=NOCH 2CH=CH2	Н	Н	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	172
297	C(Me) ₂ CH=NOCH ₂ CO ₂ Et	Н	3-I	$2\text{-Me-4-CF}_2\text{CF}_3$	
298	C(Me) 2CH=NOCH2CO2Bu-t	• Н	Н	2-Me-4-OCF ₃	153
299	C(Me) 2CH=NOCH2CONHEt	Н	Н	$2-Me-4-CF(CF_3)_2$	
300	C(Me) 2CH=NOCH2CONHEt	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
301	C(Me) 2CH=NOCH2CON(Et) 2	Н	Н	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
302	C(Me) 2CH=NOCH2CON(Et) 2	H	Н	2-Me-4-OCF ₃	131
303	C(Me) 2CH=NOCH2CON(Et) 2	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
304	(CH ₂) ₂ CH=NOMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	197
305	(CH ₂) ₃ CH=NOMe	Н	Н	2-Me-4-OCF_3	108
306	(CH ₂) ₃ CH=NOEt	Н	Н	2-Me-4-OCF_3	107
307	(CH ₂) ₄ CH=NOMe	Н	Н	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_3$	110
308	(CH ₂) ₄ CH=NOEt	Н	Н	$2\text{-Me}\text{-}4\text{-OCF}_3$	117
309	CH(Me)CH ₂ CH=NOMe	Н	3-I	$2-Me-4-CF(CF_3)_2$	170
310	C(Me) ₂ CH=NOMe	Н	3-I	2-Me-4-OCF₂CHFC	F ₃ 188
311	C(Me) 2CH=NOMe	Н	Н	2-Me-4-0-(3-C1	
				-5-CF ₃ -2-Pyr)	170
312	C(Me)₂CH=NOMe	Н	Н	3-0CF ₂ 0-4	18
313	C(Me) 2CH=NOMe	Н	Н	3-0CF ₂ CF ₂ -0-4	19
314	CH(Me)CH=NOCH ₂ Pr-c	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	142
315	CH(Me)CH=NOCH₂CH₂SEt	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	16
316	CH(Me)CH=NOCH2CH2OEt	Н	3-I	$2-Me-4-CF(CF_3)_2$	107
317	CH(Me)CH=NOCH₂CH=CH₂OE	t H	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	103
318	C(Me) 2CH=NOCH2COOBu-t	Н	3-I	$2-Me-4-CF(CF_3)_2$	101
319	C(Me) 2CH=NOCH2CONEt2	Н	3-I	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	97

第1表 (続き)

No.	-A¹-B-R¹	R ³	X		Ym	物
320	CH (Me) CONHCH2CH2OM	e	Н	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
321	CH (Me) CONHCH₂CH₂CH	₂ SMe	Н	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
322	CH (Me) CONHCH ₂ CF ₃		н :	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
第2章	表 $(Q^1=Q^2=Q^3=Q^4=Q^5=C_1$ -A ¹ -B-R ¹	$Z^1=S$,	Z ² =0,	, R ³	=H) Ym	物
				, R ³		物
						物
No.	-A¹-B-R¹	R²	Х		Ym	物
No.	-A'-B-R' CH (Me) CH=NOMe	R² H	X 3-C	1	Ym 2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	物
No. II-1 II-2	-A'-B-R' CH (Me) CH=NOMe CH (Me) C (Me) =NOMe	R² H	Х 3-С Н	1	Ym 2-Me-4-CF(CF ₃) ₂ 2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	物

第3表 (R²=R³=H, Z¹=Z²=0)

No.	-A¹-B-R¹	Q¹	Q²	Q ³	Q⁴	Q ⁵	Ym	物性
III-	CH (Me) CONHMe	C-I	СН	СН	СН	N	2-Me-6-OCF(CF ₃) ₂	
III-2	CH(Me)CON(Me)	₂ C-I	СН	СН	СН	N	2-Me-6-OCF(CF ₃) ₂	
111-3	B C(Me)₂CH=NOH	C-I	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-OCF(CF}_3)_2$	192
III-4	C (Me) 2CH=NOMe	СН	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-OCF(CF}_3)_2$	
111-5	C (Me) 2CH=NOMe	C-I	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-OCF(CF}_3)_2$	198
III-6	CH(Me)CONHEt	СН	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-OCF(CF}_3)_2$	220
III-7	CH(Me)CON(Et)	₂ CH	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-OCF(CF}_3)_2$	
III-8	3 CH(Me)C(=0)H	СН	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-}0\text{CF(CF}_3)_2$	
111-9	CH (Me) CH=NOH	CH	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-}0\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	101
III-1	0 CH(Me)CH=NOMe	СН	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-OCF(CF}_3)_2$	105
III-1	1 CH(Me)CH=NOMe	C-I	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-OCF(CF}_3)_2$	160
III-1	2 CH(Me)CONHEt	СН	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-CF(CF}_3)_2$	
III-1	.3 CH(Me)CON(Et)	₂ CH	СН	СН	СН	N	$2-Me-6-CF(CF_3)_2$	
III-1	4 C(Me) ₂ CH=NOH	CH	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-CF(CF}_3)_2$	208
III-1	5 C(Me) ₂ CH=NOMe	СН	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-CF(CF}_3)_2$	162
III-1	6 C(Me) ₂ CH=NOMe	C-I	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-CF(CF}_3)_2$	
III-1	7 CH(Me)CONHEt	СН	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	
III-1	8 CH(Me)CON(Et)	₂ CH	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	
III-1	9 CH(Me)C(=0)H	СН	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-CF(CF}_3)_2$	
III-2	0 CH(Me)CH=NOH	СН	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-CF(CF}_3)_2$	
III-2	21 CH(Me)CH=NOMe	СН	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-CF(CF}_3)_2$	
111-2	22 CH(Me)CH=NOMe	C-I	СН	СН	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-CF(CF}_3)_2$	
III-2	3 CH(Me) CONHEt	N	СН	СН	СН	СН	$2-Me-4-CF(CF_3)_2$	
III-2	24 CH(Me)CH=NOMe	N	СН	СН	СН	СН	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	

445	2	表	(続き	とり
匆	J	잸	が元さ	^ /

	No.	-A¹-B-R¹	Q۱	Q²	dz	Q⁴	Q ⁵	Ym	物性
	111-25	CH(Me)CON(Et) ₂	СН	N	СН	СН	СН	2-Me-4-CF (CF ₃) ₂	
	III-26	CH (Me) CH=NOMe	СН	N	СН	СН	СН	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	180
5	111-27	CH(Me)CONHEt	СН	СН	N	СН	СН	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	III-28	CH(Me)CH=NOMe	СН	СН	N	СН	СН	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	III-29	CH(Me)CON(Et) ₂	СН	СН	СН	N	СН	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	111-30	CH(Me)CH=NOMe	СН	СН	СН	N	СН	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	153
-	III-31	CH(Me)CH=NOMe	N	СН	N	СН	СН	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	
10	III-32	CH(Me)CH=NOMe	СН	N	СН	N	СН	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	III-33	$CH(Me)CON(Et)_{z}$	СН	СН	N	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-OCF(CF}_3)_2$	
	III-34	CH(Me)CH=NOMe	СН	СН	N	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-OCF(CF}_3)_2$	
	III-35	$CH(Me)CON(Et)_2$	СН	СН	N	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-CF(CF}_3)_2$	
	III-36	CH(Me)CH=NOMe ₂	СН	СН	N	СН	N	$2\text{-Me-}6\text{-CF(CF}_3)_2$	•

¹⁵ 注:第3表中、Q⁵が窒素原子を示す場合、Ymの置換位置は窒素原子を1位と する。

本発明の一般式(I) で表される芳香族ジアミド誘導体又はその塩類を有効成分 として含有する農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は水稲、果樹、野菜、その他 の作物及び花卉等を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等 の害虫防除に適しており、例えばリンゴコカクモンハマキ(Adoxophyes orana 5 fasciata)、チャノコカクモンハマキ (Adoxophyes sp.)、リンゴコシンクイ (Grapholita inopinata)、ナシヒメシンクイ (Grapholita molesta)、マメ シンクイガ (Leguminivora glycinivorella) 、クワハマキ (Olethreutes mori) チャノホソガ (Caloptilia thevivora) 、リンゴホソガ (Caloptilia zachrysa)、キンモンホソガ(Phyllonorycter ringoniella)、ナシホソガ (Spulerrina astaurota)、モンシロチョウ (Piers rapae crucivora)、オ 10 オタバコガ類 (Heliothis sp.)、コドリンガ (Laspey resia pomonella)、 コナガ (Plutella xylostella) 、リンゴヒメシンクイ (Argyresthia conjugella)、モモシンクイガ (Carposina niponensis)、ニカメイガ (Chilo suppressalis)、コブノメイガ (Cnaphalocrocis medinalis)、チャマダラメ 15 イガ (Ephestia elutella) 、クワノメイガ (Glyphodes pyloalis) 、サンカ メイガ (Scirpophaga incertulas) 、イチモンジセセリ (Parnara guttata) 、 アワヨトウ (Pseudaletia separata) 、イネヨトウ (Sesamia inferens) 、ハ スモンヨトウ(Spodoptera litura)、シロイチモンジョトウ(Spodoptera exigua) 、等の鱗翅目害虫、フタテンヨコバイ (Macrosteles fascifrons) 、 ツマグロヨコバイ (Nephotettix cincticeps) 、トビイロウンカ (Nilaparvata 20 lugens)、セジロウンカ (Sogatella furcifera)、ミカンキジラミ (Diaphorina citri)、ブドウコナジラミ (Aleurolobus taonabae)、タバコ コナジラミ (Bemisia tabaci) 、オンシツコナジラミ (Trialeurodes vaporariorum)、ニセダイコンナブラムシ (Lipaphis erysimi)、モモアカア ブラムシ (Myzus persicae)、ツノロウムシ (Ceroplastes ceriferus)、ミ カンワタカイガラムシ (Pulvinaria aurantii) 、ミカンマルカイガラムシ (Pseudaonidia duplex) 、ナシマルカイガラムシ (Comstockaspis perniciosa)、ヤノネカイガラムシ (Unaspis yanonensis) 等の半翅目害虫、 ネグサレセンチュウ (Pratylenchus sp.) 、ヒメコガネ (Anomala

WO 01/21576

25

rufocuprea)、マメコガネ(Popillia japonica)、タバコシバンムシ (Lasioderma serricorne) 、ヒラタキクイムシ(Lyctus brunneus) 、ニジ ュウヤホシテントウ(Epilachna vigintiotopunctata)、アズキゾウムシ (Callosobruchus chinensis) 、ヤサイゾウムシ (Listroderes 5 costirostris)、コクゾウムシ(Sitophilus zeamais)、ワタミゾウムシ (Anthonomus gradis gradis)、イネミズゾウムシ(Lissorhoptrus oryzophilus)、ウリハムシ(Aulacophora femoralis)、イネドロオイムシ (Oulema oryzae)、キスジノミハムシ(Phyllotreta striolata)、マツノ キクイムシ(Tomicus piniperda)、コロラドポテトビートル(Leptinotarsa decemlineata)、メキシカンビーンビートル (Epilachna varivestis)、コー ンルートワーム類(Diabrotica sp.)等の甲虫目害虫、ウリミバエ (Dacus(Zeugodacus) cucurbitae) 、ミカンコミバエ (Dacus(Bactrocera) dorsalis)、イネハモグリバエ (Agromyza oryzae)、タマネギバエ (Delia antiqua)、タネバエ (Delia platura)、ダイズサヤタマバエ (Asphondylia sp.)、イエバエ (Musca domestica)、アカイエカ (Culex pipiens 15 pipiens) 等の双翅目害虫、ミナミネグサレセンチュウ (Pratylenchus coffeae)、ジャガイモシストセンチュウ (Globodera rostochiensis)、ネコ ブセンチュウ(Meloidogyne sp.)、ミカンネセンチュウ(Tylenchulus semipenetrans)、ニセネグサレセンチュウ(Aphelenchus avenae)、ハガレ 20 センチュウ (Aphelenchoides ritzemabosi) 等のハリセンチュウ目害虫等に対 して強い殺虫効果を有するものである。

本発明の一般式(I) で表される芳香族ジアミド誘導体又はその塩類を有効成分とする農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するものであるので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の水田水、茎葉又は土壌に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。

本発明の農園芸用薬剤は、農薬製剤上の常法に従い、使用上都合の良い形状

に製剤して使用するのが一般的である。

即ち、一般式(I) で表される芳香族ジアミド誘導体又はその塩類は、これらを 適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶 解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させ、適宜の剤形、例えば懸濁 5 剤、乳剤、液剤、水和剤、粒剤、粉剤、錠剤等に製剤して使用すれば良い。

本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、 固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、 鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、 粉砕合成樹脂等の合成重合体、粘土類(例えばカオリン、ベントナイト、酸性白 10 土等)、タルク類(例えばタルク、ピロフィライド等)、シリカ類(例えば珪藻 土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン〔含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成 高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。〕)、 活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉砕物、フライアッシュ、砂、 炭酸カルシウム、燐酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、硫安、燐安、硝安、尿素、 15 塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以 上の混合物の形で使用される。

液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶 媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうることとなる ものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これら 20 は単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類 (例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレング リコール等)、ケトン類(例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブ チルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等)、エーテル類(例えば エチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロ 25 フラン等)、脂肪族炭化水素類(例えばケロシン、鉱油等)、芳香族炭化水素類 (例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレ ン等)、ハロゲン化炭化水素類(例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化 炭素、塩素化ベンゼン等)、エステル類(例えば酢酸エチル、ジイソプロピルフ タレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等)、アミド類(例えば ジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等)、ニトリル類(例えばアセトニトリル等)、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これら 5 の補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用 し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び/又は湿潤の目的のために界面活性 剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレ ンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオ 10 キシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、 ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、 ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エス テル等の界面活性剤を例示することができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び/又は結合の目的のために、次に 15 例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸 塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコーン油等の補助剤を使用することもできる。

有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、例えば粉剤或 25 いは粒剤とする場合は0.01~50重量%、又乳剤或いは水和剤とする場合も 同様0.01~50重量%が適当である。

本発明の農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除に有効な量を当該害虫の発生が予測される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用

すれば良い。

又、農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は防除対象の植物の種子又は播種する ための栽培担体(例えば、播種土壌、育苗マット、水等)等に適用して使用する こともでき、稲育苗箱施用、種子粉衣等の施用方法、種子消毒法等の施用方法で 5 使用することができ、果樹、穀類、野菜等の畑作において発生する害虫に対して は粉衣や浸漬等の種子処理、育苗用の栽培容器や植え穴等の育苗担体等に灌注、 表面散布後灌水等をして植物に吸収させて使用することもでき、水耕栽培におけ る水耕液に処理することもできる。

本発明の農園芸用薬剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物 10 の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施 用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.1g~ 10kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の農園芸用薬剤は、更に防除対象病害虫、防除適期の拡大のため、或い は薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用病虫害防除剤と混合して使用すること 15 も可能である。

実施例

以下に本発明の代表的な実施例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

実施例1.

20 (1-1). $3-3-ド-1-N-(4-\sim 7$ タフルオロイソプロピルー2-メチルフェニル)-フタルアミド酸の製造

3-ヨードフタル酸無水物3.5gのアセトニトリル30ml 懸濁液に、氷冷下、4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルアニリン3.5gのアセトニトリル3ml溶液を徐々に滴下し、滴下終了後、3時間室温で攪拌下に反応を行った。反応終了後、析出した結晶を濾取し、少量のアセトニトリルで洗浄することにより、目的物4.0gを得た。

物性:m. p. 174~181℃ 収率:57%

(1-2). $3-3-ド-N-(4-\sim 7$ $4-\sim 7$ $4-\sim 7$ $4-\sim 7$ $4-\sim 7$ $4-\sim 7$ $5-\sim 7$

3-ヨード-1-N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-フタルアミド酸2.0gのトルエン10ml懸濁液に、トリフルオロ酢酸無水物1.1gを加え、室温で30分間攪拌下に反応を行った。反応終了後、溶媒を減圧下に留去して目的物の粗生成物2.0gを得た。得られた目的物は精製5 することなく次の反応に使用した。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS 、δ値(ppm)]

2. 4(3H. s), 7. 3(1H. d), 7. 4(2H. m), 7. 5(1H. t), 8. 1(1H. d), 8. 2(1H. d).

(1-3). $3-3-ド-N^1-(4-\Lambda プタフルオロイソプロピルー2-メチルフェニル) <math>-N^2-(1-\lambda \mathcal{F})$ (N, N-ジメチルカルバモイル) エ 10 チル)フタル酸ジアミド(化合物No. 77)の製造

3-ヨードーN-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)フタル酸イソイミド1.0gをアセトニトリル10mlに溶解し、該溶液に3-アミノーN,N-ジメチルブタン酸アミド・塩酸塩0.35g及びトリエチルアミン0.21gを加えて、室温下に10時間攪拌した。反応終了後、反応混液を15 氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物0.40gを得た。

物性:m. p. 126℃ 収率:32%

実施例 2. $3-3-F-N^{1}-(4-n)^{2}$ つ $3-3-F-N^{2}-(1-x)^{2}$ ($3-3-F-N^{2}-(1-x)^{2}$) エチル) $3-3-F-N^{2}$ ($3-3-F-N^{2}$) アミド (化合物No. 136) の製造

3-ヨード-N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)フタル酸イソイミド0.9gをアセトニトリル10mlに溶解し、該溶液に塩酸1-メチル-2-(メトキシイミノ)エチルアミン0.34g及びトリエチルアミン0.25gを加えて、室温下に10時間攪拌した。反応終了後、反応混液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物0.36gを得た。

物性:m. p. 192℃ 収率:36%

実施例3.

(3-1). 3-ヨード-2-N-〔1-メチル-2-(エトキシカルボニル) エチル〕-フタルアミド酸の製造

3-ヨードフタル酸無水物2.7gのアセトニトリル30ml 懸濁液に、氷5 冷下、3-アミノ酪酸エチル1.4gのアセトニトリル3ml溶液を徐々に滴下し、滴下終了後、3時間室温で攪拌下に反応を行った。反応終了後、析出した結晶を濾取し、少量のアセトニトリルで洗浄することにより、目的物3.8gを得た。

収率:97%

10 (3-2). 6-ヨード-N-[1-メチル-2-(エトキシカルボニル)エチル]-フタル酸イソイミドの製造

3-ヨード-2-N-〔1-メチル-2-(エトキシカルボニル)エチル〕-フタルアミド酸1.0gのトルエン10ml懸濁液に、トリフルオロ酢酸無水物1.1gを加え、室温で30分間攪拌下に反応を行った。反応終了後、溶媒を減15 圧下に留去して目的物の粗生成物0.9gを得た。得られた目的物は精製することなく次の反応に使用した。

(3-3). $3-3-ド-N^{1}-(4-\sim 797)$ ルオロイソプロピルー2-メチルフェニル) $-N^{2}-[1-メチル-2-(エトキシカルボニル)$ エチル] フタル酸ジアミド (化合物No. 11) の製造

20 6-ヨードーNー〔1-メチルー2-(エトキシカルボニル)エチル〕-フタル酸イソイミド 0.9 gをアセトニトリル10mlに溶解し、該溶液に4-ヘプタフルオロイソプロピルー2-メチルアニリン 0.5 g及びトリフルオロ酢酸 2滴を加えて、室温下に10時間攪拌した。反応終了後、反応混液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで 乾燥し、減圧下に溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物 0.5 0 gを得た。

物性: ペースト状 収率:31%

1.1-1.4(5H.m), 2.4(3H.s), 2.5-2.6(2H.m), 4.1(2H.q), 4.4-4.5(1H.m),

¹H-NMR [CDCl₃/TMS 、δ値(ppm)]

6.8(1H.d), 7.2(1H.t), 7.4-7.5(2H.m), 7.8(1H.d), 7.9(1H.d), 8.3(1H.d), 8.5(1H.s).

実施例 4. $3-3-F-N^{1}-(4-\Lambda プタフルオロイソプロピルー2-メチルフェニル)-N^{2}-(3-オキソプタン-2-イル)フタル酸ジアミド(化合物 5 No. 134)の製造$

3-ヨード-N-(4-ヘプタフルオロイソプロピルー2-メチルフェニル) フタル酸イソイミド1.5gをアセトニトリル10mlに溶解し、該溶液に3-アミノブタノン・塩酸塩0.35g及びトリエチルアミン0.29gを加えて、室温下に10時間攪拌した。反応終了後、反応混液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物0.70gを得た。

物性:m. p. 189℃ 収率:41%

以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定さ 15 れるものではない。

尚、製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

製剤例1.

第1表~第3表記載の化合物 50部 40部 20 ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物 10部 以上を均一に混合溶解して乳剤とする。 製剤例 2.

第1表~第3表記載の化合物3部25クレー粉末8 2部珪藻土粉末1 5部

以上を均一に混合粉砕して粉剤とする。

製剤例3.

第1表~第3表記載の化合物

5部

52

ベントナイトとクレーの混合粉末

90部

リグニンスルホン酸カルシウム

5部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。 製剤例4.

5 第1表~第3表記載の化合物

20部

カオリンと合成高分散珪酸

75部

ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルとアル

キルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物

5部

71.35部

以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

10 製剤例 5.

水

第1表~第3表記載の化合物20部アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム3部プロピレングリコール5部ジメチルポリシロキサン0.25部パラクロロメタキシレノール0.10部キサンタンガム0.30部

以上を均一に混合湿式粉砕し、水和剤又は水性懸濁剤とする。

試験例1. コナガ (Plutella xylostella) に対する殺虫試験

20 ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を第1表~第3表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50pmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室に静置した。薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準に従って判定を行った。1区10頭3連制

25

15

無処理区孵化虫数 - 処理区孵化虫数 補正死虫率 (%) = -----×100 無処理区孵化虫数

53

判定基準. A・・・死虫率100%

B・・・死虫率99%~90%

C・・・死虫率89%~80%

D···死虫率79%~50%

5 試験例2. ハスモンヨトウ (Spodoptera litura) に対する殺虫試験

第1表~第3表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50ppmに希釈した薬液にキャベツ葉片(品種:四季穫)を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレに入れ、ハスモンヨトウ2令幼虫を接種した後、蓋をして25℃の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、下記の式により死10 虫率を算出し、判定基準は試験例1に従って行った。1区10頭3連制

15

試験例3.チャノコカクモンハマキ(Adoxophyes sp.)に対する殺虫試験

第1表~第3表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50ppmに希釈した薬液にチャ葉を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレに入れ、チャノコカクモンハマキ幼虫を接種した後、25℃、湿度70%の恒温室20 に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、試験例1の判定基準に従って判定を行った。1区10頭3連制

試験の結果、コナガに対してB以上の殺虫活性を示した化合物は2~11、70~78、134、136~141、177、204、205、207、215~219、226、229、230~237、239、241~296、298、25302、304、306、309、III-3、III-5、III-9~III-11、III-14、III-15、III-26及びIII-30であり、ハスモンヨトウに対してB以上の殺虫活性を示した化合物は11、71~74、77、78、136~140、204、205、207、216、226、246、248、256、258、260、263、265、272、275、

54

277~279、284~286、291、292、309、III-3、III-5及びIII-11であり、チャノコカクモシハマキに対してB以上の殺虫活性を示した化合物は7、11、70~72、74~78、134、136~140、204、205、207、216、218、219、226、2465~250、253、254、256、258、259、263、265、266、271~273、275~279、281、283、285、286、290、291、296、298、304、309、III-3、III-5、III-10、III-11、III-15及びIII-26であった。

55

請求の範囲

1. 一般式(I)

 ${式中、<math>A^1$ は (C_1-C_8) アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン 10 原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁-C₆)アルコキシ 基、ハロ (C₁-C₆)アルコキシ基、 (C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆)ア ルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルス ルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスル ホニル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ 15 カルボニル基又はフェニル基から選択される1以上の置換基を有する置換(C₁-C₈)アルキレン基、 (C₃-C₈)アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロ ゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆) アルコ キシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) (C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキ ルスルフィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル 20 スルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコ キシカルボニル基又はフェニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 (C₃-C₈)アルケニレン基、(C₃-C₈) アルキニレン基又は同一若しくは異なっ ても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ 25 基、ハロ (C₁-C₆)アルキルチオ基、 (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基又はフェニル基から選択される1以上の置換

基を有する置換 (C3-C8)アルキニレン基を示す。

又、前記(C_1 - C_8)アルキレン基、置換(C_1 - C_8)アルキレン基、(C_3 - C_8)アルケニレン基、置換(C_3 - C_8)アルケニレン基、(C_3 - C_8)アルキニレン基又は置換(C_3 - C_8)アルキニレン基中の任意の飽和炭素原子は(C_2 - C_5)アルキレン 基で置換されて(C_3 - C_6)シクロアルカン環を示すこともでき、前記(C_1 - C_8)アルキレン基、置換(C_1 - C_8)アルキレン基、(C_3 - C_8)アルケニレン基、置換(C_3 - C_8)アルケニレン基中の任意の 2 個の炭素原子はアルキレン基又はアルケニレン基と一緒になって(C_3 - C_6)シクロアルカン環又は(C_3 - C_6)シクロアルケン環を示すこともできる。

10 Bは $-CO-又は-C(=N-OR^4)-(式$ 中、 R^4 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_3-C_6) アルケニル基、ハロ (C_3-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) アルケニル基、 (C_1-C_4) アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から 選択される 1以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_4) アルキル基を示す。)を示す。

 R^{1} は水素原子、 $(C_{1}-C_{6})$ アルキル基、ハロ $(C_{1}-C_{6})$ アルキル基、 $(C_{2}-C_{6})$ アルケニル基、ハロ $(C_{2}-C_{6})$ アルケニル基、 $(C_{3}-C_{6})$ シクロアルキル基、ハロ $(C_{3}-C_{6})$ シクロアルキル基、 $(C_{1}-C_{6})$ アルコキシ基、ハロ $(C_{1}-C_{6})$ アル コキシ基、 $(C_{1}-C_{6})$ アルキルチオ基、モノ $(C_{1}-C_{6})$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $(C_{1}-C_{6})$ アルキルアミノ基、コェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $(C_{1}-C_{6})$ アルキル基、ハロ $(C_{1}-C_{6})$ アルキル基、 $(C_{1}-C_{6})$ アルキル基、 $(C_{1}-C_{6})$ アルキル基、 $(C_{1}-C_{6})$ アルキル基、 $(C_{1}-C_{6})$ アルコキシ基、ハロ $(C_{1}-C_{6})$ アルコキシ基、ハロ $(C_{1}-C_{6})$ アルコキシ基、ハロ $(C_{1}-C_{6})$ アルコキシ

ルキルチオ基、 (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルス ルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスル ホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1 5 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても 良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁- C_6)アルキル基、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1 - C_6)$ C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフ ィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホ 10 ニル基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル基、モノ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ 基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基又は(C_1 - C_6)アル コキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル アミノ基、フェニルオキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ 基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) ア 15 ルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) ア ルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良 いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選 択される1以上の置換基を有する置換フェニルオキシ基、フェニルチオ基、同一 20 又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル 基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆)アルコ キシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) 25 アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シ アノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6)

 C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。又、 R^1 は A^1 と結合して、 $1\sim 2$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $4\sim 7$ 員環を形成することができる。

 R^2 及び R^3 は同一又は異なっても良く、水素原子、 (C_3-C_6) シクロアルキ 10 ル基、-A²-R⁵ (式中、A²は-C (=O) -、-C (=S) -、-C (=N R^6) - (式中、 R^6 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ 基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) ア ルキルアミノ基、 (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、フェニル基又は同一若し くは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル 15 基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆)アルコ キシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 20 フェニル基を示す。)、 (C_1-C_8) アルキレン基、ハロ (C_1-C_8) アルキレン基、 (C₃-C₆)アルケニレン基、ハロ(C₃-C₆) アルケニレン基、(C₃-C₆)アルキニ レン基又はハロ (C₃-C₆)アルキニレン基を示し、

(1) A^2 が-C (=O) -、-C (=S) -又は-C (=NR 6) - (式中、 R^6 は前記に同じ。)を示す場合、 R^5 は水素原子、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_3 - C_6)シクロアルキル基、ハロ(C_3 - C_6)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_1 - C_6)アルキル

ルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハ $口(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又 は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカル ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同 一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキ ル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アル コキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_1 - C_6)$ 10 C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基 又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する 置換複素環基又は $-A^3-R^7$ (式中、 A^3 は-O-、-S-又は-N (R^8) -(式中、R⁸は水素原子、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、ハロ(C₁-C₆)アル キルカルボニル基、 (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、フェニルカルボニル基、 同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アル キル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) ア ルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) 20 C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基 又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する 置換フェニルカルボニル基、フェニル (C₁-C₄)アルコキシカルボニル基又は同 一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) ア ルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) 25 アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルア

ミノ基又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル(C_1 - C_4)アルコキシカルボニル基を示す。)を示し、 \mathbf{R}^7 は(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_3 - C_6)アルケニル基、ハロ(C_3 - C_6)アルケニル基、(C_3 - C_6)アルケニル基、ハロ(C_3 - C_6)アルケニル基、ハロ(C_3 - C_6)アルキル基、ハロ(C_3 - C_6)シクロアルキル基、(C_1 - C_6)アルキルカルボニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルカルボニル基、(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン

 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、((C_1-C_6) アルコキシオ

- 10 基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル(C_1 -
- 15 C_4)アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、((C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、((C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、((C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル
- 20 基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル(C_1 - C_4)アルキル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アル
- 25 コキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する

置換複素環基を示す。)を示す。

(2) A^2 が (C_1-C_8) アルキレン基、ハロ (C_1-C_8) アルキレン基、 (C_3-C_6) アルケニレン基、ハロ (C_3-C_6) アルケニレン基、 (C_3-C_6) アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6) アルキニレン基を示す場合、 R^5 は水素原子、ハロゲン原子、

61

- 5 シアノ基、ニトロ基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフ
- 10 ィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 -
- 15 C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキ
- 20 ルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換 基を有する置換複素環基又は $-A^4-R^9$ (式中、 A^4 は-O-、-S-、-S O-、 $-SO_2-$ 、-N (R^8) (式中、 R^8 は前記に同じ。)、-C (=O) -又は-C ($=NOR^4$) (式中、 R^4 は前記に同じ。) を示し、
 - (i) A^4 が-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2-$ 又は-N (R^8) (式中、
- 25 R^8 は前記に同じ。)を示す場合、 R^9 は水素原子、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_3 - C_6)アルケニル基、ハロ(C_3 - C_6)アルキニル基、ハロ(C_3 - C_6)アルキニル基、ハロ(C_3 - C_6)アルキニル基、(C_3 - C_6)シクロアルキル基、(C_1 - C_6)アルキルカルボニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルカルボニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルカルボニル基、フェ

ニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁- C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチ オ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニ 5 ル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキ ルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換 基を有する置換フェニル基、フェニル (C₁-C₄)アルキル基、同一又は異なって も良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁ 10 $-C_6$)アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) $-C_6$)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスル フィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスル ホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミ ノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) ア 15 ルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニ ル (C₁-C₄)アルキル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン 原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ 基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ 20 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は 異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボ ニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

(ii) A^4 が-C(=O) -又は-C($=N-OR^4$) -(式中、 R^4 は前記に 25 同じ。)を示す場合、 R^9 は水素原子、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ(C_1-C_6)アルキル基、(C_2-C_6)アルケニル基、ハロ(C_2-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ルチオ基、モノ(C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1-C_6)アルキルチオ基、モノ(C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1-C_6)アルキルアミノ

キルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基又は(C_1 C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、フェニルオキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、 C_1 - C_6)アルキルチオ基、 C_1 - C_6)アルキルチオ基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ

25 C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアシー、フェースは異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアシーを

ルアミノ基又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。)を示す。〕を示す。

又、 R^2 tA^1 又 tA^1 と 結合して、 $1\sim 2$ 個の同一又 t 異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $4\sim 7$ 員環を形成することができる。

 $Q^1 \sim Q^4$ は同一又は異なってもよく、窒素原子又はX(Xは後記に示す。) 15 で置換されても良い炭素原子を示し、Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原 子、シアノ基、ニトロ基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロ アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっ ても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキル 20 スルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、 (C₁-C₆)アルキル スルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキル アミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基又は(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニ 25 ル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハ $D(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハ $D(C_1-C_6)$ アルキル チオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィ ニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル

基、モノ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^5$ - R^{10} 〔式中、 A^5 は-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2$ -、-C(=O) -、-C(= NOR^4) - (式中、 R^4 は 前記に同じ。)、(C_1 - C_6)アルキレン基、ハロ(C_1 - C_6)アルキレン基、(C_2 - C_6)アルケニレン基、ハロ(C_2 - C_6)アルケニレン基、スロ(C_3 - C_6)アルキニレン基を示し、

(1) A^5 が-O-、-S-、-SO-又は $-SO_2-$ を示す場合、 R^{10} はハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルケニル基、フェニル

- 10 基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 - C_6) アルキル基、ハロ(C_1 - C_6) アルキル基、ハロ(C_1 - C_6) アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6) アルコキシ基、(C_1 - C_6) アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1 - C_6) アルキルスルホニル基、モノ
- 15 (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキルチオ基、ハ
- 20 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、ハ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、モノ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基又は $\Gamma(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基から選択される $\Gamma(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基から
- 25 は (C_1-C_6) アルキレン基、ハロ (C_1-C_6) アルキレン基、 (C_3-C_6) アルケニレン基、ハロ (C_3-C_6) アルケニレン基、 (C_3-C_6) アルケニレン基又はハロ (C_3-C_6) アルキニレン基を示し、 (C_3-C_6) アルキニレン基を示し、 (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ

25

基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキ ルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフ ィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニ 5 ル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上 の置換基を有する置換フェニル基又は $-A^7-R^{12}$ (式中、 A^7 は-O-、-S-、-SO-又は-SO $_2$ -を示し、 R^{12} は (C_1 - C_6)アルキル基、ハロ (C_1 - C_6)アルキル基、 (C_3-C_6) アルケニル基、ハロ (C_3-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) 10 C_6)アルキニル基、ハロ (C_3-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、 ハロ (C₃-C₆)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロ ゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキ ル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキ ルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 15 ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハ $D(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又 は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカル ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基又は 同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C₁-C₆) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) C_6)アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルア

(2) A^{5} が-C (=O) -又は-C (=NOR 4) - (式中、 R^{4} は前記に同じ。)を示す場合、 R^{10} は (C_{1} - C_{6})アルキル基、ハロ (C_{1} - C_{6})アルケニル基、(C_{2} - C_{6})アルケニル基、(C_{3} - C_{6})シクロアルキ

ミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を

有する置換複素環基を示す。)を示す。)を示し、

ル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) ア ルキルチオ基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン 原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ 基、ハロ (C₁-C₆)アルキルチオ基、 (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は 異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基又は(C₁-C₆)アルコキシカルボ 10 ニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ 基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) C_6)アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ 15 (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルア ミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を 環上に有する置換フェニルアミノ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、 ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) ア 20 ルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) ア ルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニ ル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホニル 基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、 同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキ 25 シカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示し、 (3) A^{5} が (C_{1} - C_{6})アルキレン基、ハロ (C_{1} - C_{6})アルキレン基、(C_{2} - C_{6}) アルケニレン基、ハロ (C_2-C_6) アルケニレン基、 (C_2-C_6) アルキニレン基又 はハロ (C_3-C_6) アルキニレン基を示す場合、 R^{10} は水素原子、ハロゲン原子、

 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アル

コキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、スロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルメルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルキルアミノ

15 C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環 基又は $-A^8-R^{13}$ (式中、 A^8 は-O-、-S-、-SO-又は $-SO_2-$ を 示し、 R^{13} は(C_3-C_6)シクロアルキル基、ハロ(C_3-C_6)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6)アルキル基、ハロ(C_1-C_6)アルキル基、ハ

20 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、ハ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキル チオ基、 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、 $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、モノ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $\Gamma(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基又は $\Gamma(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の

25 置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルチオースルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ

 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は 異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボ ニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は-A⁹-R¹⁴ (式中、 A^9 は(C_1 - C_6)アルキレン基、ハロ(C_1 - C_6)アルキレン基、(C_2 -5 C_6)アルケニレン基、ハロ (C_2-C_6) アルケニレン基、 (C_2-C_6) アルキニレン基 又はハロ (C_3-C_5) アルキニレン基を示し、 R^{14} は水素原子、ハロゲン原子、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アル コキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) C_6)アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキ 10 ルスルフィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル スルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 ニトロ基、 $(C_1 - C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル基、 $(C_1 - C_6)$ アルコ キシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) C_6)アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキ 15 ルスルフィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル スルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択さ れる1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なって も良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁ 20 -C₆)アルキル基、 (C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆)アルコキシ基、 (C₁ $-C_6$)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスル フィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスル ホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミ ノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) ア ルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、 25 フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハ μ (C₁-C₆)アルコキシ基、 (C₁-C₆)アルキルチオ基、ハ μ (C₁-C₆)アルキル チオ基、 (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィ

ニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、

- 5 ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、
- 10 同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基を示す。)を示す。)を示す。

又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、 該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、

- 15 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、エノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。
- Q^5 は窒素原子又は炭素原子を示し、Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ(C_3 - C_6)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 - C_6)アルキル基、 $(C_1$ - C_6)アルキル基、 $(C_1$ - C_6)アルコキシ基、ハロ($(C_1$ - C_6)アルキルチオ基、ハロ($(C_1$ - (C_6))アルキルチオ基、 $(C_1$ - (C_6))アルキルスルフィニル基、 $(C_1$ - (C_6))アルキルスルフィニル基、 $(C_1$ - (C_6))アルキルスルカコィニル基、 $(C_1$ - (C_6))アルキルスルホニル基、 $(C_1$ - (C_6))アルキルアミノ基、 $(C_1$ - (C_6))アルキルアミノ基、 $(C_1$ - (C_6))アルキルアミノ基

又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1 - C_6)アルキルスルカーに、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、ロー又は異なっても良いジ(C_1 - C_6)アルキルアミノ基又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^5$ - R^{10} (式中、 A^5 及び10 R^{10} は前記に同じ。)を示す。

又、芳香環上の隣接した2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、 該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 (C₁-C₆)アルキル基、ハ $D(C_1-C_6)$ アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハ $D(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキル スルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキル 15 スルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異 なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハ ロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆)アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキル スルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキル スルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキル アミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニ ル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニ 25 トロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁-C₆)アルコキ シ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル スルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルス ルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁

 $-C_6$)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換複素環基から選択される 1以上の置換基を有することもでき、mは $0\sim5$ の整数を示す。

 Z^{1} 及び Z^{2} は同一又は異なっても良く、酸素原子又は硫黄原子を示す。 $}$ で表される芳香族ジアミド誘導体又はその塩類。

- A^{1} が $(C_{1}-C_{8})$ アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原 子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキ ルチオ基、 (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフ 10 ィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニ ル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカル ボニル基又はフェニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 (C₁-C₈) アルキレン基、 (C₃-C₈)アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン 原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ 15 基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) ア ルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルス ルフィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスル ホニル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ カルボニル基又はフェニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 (C3-20 C_8)アルケニレン基、 (C_3-C_8) アルキニレン基又は同一若しくは異なっても良 く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁- C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハ ロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) C_6)アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) 25 アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルキル C₆)アルコキシカルボニル基又はフェニル基から選択される1以上の置換基を有
 - 又、前記 (C_1-C_8) アルキレン基、置換 (C_1-C_8) アルキレン基、 (C_3-C_8) アルケニレン基、置換 (C_3-C_8) アルケニレン基、 (C_3-C_8) アルキニレン基又は

する置換 (C₃-C₈)アルキニレン基を示す。

置換(C_3 - C_8)アルキニレン基中の任意の飽和炭素原子は(C_2 - C_5)アルキレン 基で置換されて(C_3 - C_6)シクロアルカン環を示すこともでき、前記(C_1 - C_8)アルキレン基、置換(C_1 - C_8)アルキレン基、(C_3 - C_8)アルケニレン基、置換(C_3 - C_8)アルケニレン基中の任意の 2 個の炭素原子はアルキレン基又はアルケ ニレン基と一緒になって(C_3 - C_6)シクロアルカン環又は(C_3 - C_6)シクロアルケン環を示すこともできる。

Bが-CO-又は-C(=N-OR 4)-(式中、R 4 は水素原子、(1 C₁-C₆)アルキル基、ハロ(1 C₁-C₆)アルキル基、(1 C₃-C₆)アルケニル基、ハロ(1 C₃-C₆)アルケニル基、(1 C₃-C₆)アルケニル基、(1 C₃-C₆)アルケニル基、(1 C₃-C₆)アルケニル基、(1 C₃-C₆)アルケニル基、(1 C₁-C₄)アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(1 C₁-C₆)アルキル基、ハロ(1 C₁-C₆)アルキル基、ハロ(1 C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(1 C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(1 C₁-C₆)アルキルチオ基、(1 C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(1 C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(1 C₁-C₆)アルキルスルカニル基、モノ(1 C₁-C₆)アルキルスルホニル基、同一又は異なっても良いジ(1 C₁-C₆)アルキルアミノ基又は(1 C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル(1 C₁-C₄)アルキル基を示す。)を示す。

 R^1 が水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 ハロ (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、 ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、 (C_1-C_6) アルキルアミノ基、 (C_1-C_6) アルキルを (C_1-C_6) アルキルを (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルコキン基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルカコィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルストルアミノ基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルストルアミノ基、 (C_1-C_6) アルキルストルアミノ基、 (C_1-C_6) アルキルストルアミノ基、 (C_1-C_6) アルキルストルアミノ基、 (C_1-C_6) アルキルストルアミノ基、 (C_1-C_6) アルキルストルアミノ

 C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても 良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁- C_6)アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) 5 C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフ ィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホ ニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ 基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アル コキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル 10 アミノ基、フェニルオキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ 基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁-C₆)ア ルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) ア 15 ルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良 いジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ基又は $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル基から選 択される1以上の置換基を有する置換フェニルオキシ基、フェニルチオ基、同一 又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル 基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆)アルコ 20 キシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 25 フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シ アノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハ $D(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハ $D(C_1-C_6)$ C_6)アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)

WO 01/21576

アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。又、 R^1 は A^1 と結合して、 $1\sim2$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $4\sim7$ 員環を形成することができる。

 R^2 及び R^3 が同一又は異なっても良く、水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基を示し、

 $Q^1 \sim Q^4$ が同一又は異なっても良く、窒素原子又はX(Xは後記に示す。)で置換されても良い炭素原子を示し、Xは同一又は異なっても良く、Nログン原 P0 子、P1 子、P1 子、P2 子、P3 子、P4 上 P3 子、P4 に P4 に P5 アルキル基、P6 に P7 ルケニル基、P7 に P7 ルケニル基、P8 に P9 アルケニル基、P9 に P9 アルキニル基、P9 に P9 アルキニル基、P9 に P9 アルキニル基、P9 に P9 アルキニル基、P9 に P9 アルキルチオ基を示す。又、芳香環上の隣接した P9 個のP9 に P9 アルキルチオ基を示す。又、芳香環は同一又は異なっても良く、P9 アルギン原子、P9 アルキル基、P9 に P9 アルキル基、P9 に P9 アルキル基、P9 に P9 アルキル基、P9 に P9 アルキルチオ基、P9 に P9 アルキルチオ基、P9 に P9 アルキルチオー P9 を P9 アルキルスルフィニル基、 P9 に P9 アルキルスルフィニル基、P9 に P9 アルキルスルフィニル基、 P9 に P9 アルキルスルフィニル基、P9 に P9 アルキルスルカフィニル基、P9 に P9 アルキルスルカニル基から選択される P9 アルキルスルホニル基から選択される P9 アルキルスルホニル基を含さともできる。

 Q^5 が窒素原子又は炭素原子を示し、Yが同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ(C_3 - C_6)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1 - C_6)アルキル基、 $(C_1$ - C_6)アルキル基、($(C_1$ - (C_6))アルキル基、ハロ($(C_1$ - (C_6))アルキル基、ハロ($(C_1$ - (C_6))アルキルチオ基、ハロ($(C_1$ - (C_6))アルキルチオ基、($(C_1$ - (C_6))アルキルスルフィニル基、ハロ($(C_1$ - (C_6))アルキルスルフィニル基、($(C_1$ - (C_6))アルキルスルホニル基、ハロ($(C_1$ - (C_6))アルキルスルホニル基、モノ($(C_1$ - (C_6))アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ($(C_1$ - (C_6))アルキルアミノ基、又は($(C_1$ - (C_6))アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、

ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル スルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は (C_1-C_6) アルコキンカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は (C_1-C_6) アルコキンカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は (C_1-C_6) アルコキンカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は (C_1-C_6) アルコキンカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は (C_1-C_6) アルコキンカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は (C_1-C_6) アルコキンカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する

又、芳香環上の隣接した2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、 10 該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 (C₁-C₆)アルキル基、ハ $D(C_1-C_6)$ アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハ $D(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキル スルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキル スルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異 15 なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル基、ハ $D(C_1-C_6)$ アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハ $D(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキル スルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキル スルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキル 20 アミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニ ル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニ トロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキ シ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) 25 アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル スルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルス ルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁ $-C_6$)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1 以上の置換基を有する置換複素環基から選択される1以上の置換基を有すること

もでき、mは0~5の整数を示し、

25 する置換 (C_3-C_8) アルキニレン基を示し、

 Z^{1} 及び Z^{2} は酸素原子を示す請求項1記載の芳香族ジアミド誘導体又はその 塩類。

 A^{1} が $(C_{1}-C_{8})$ アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原 3. 5 子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキ ルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフ ィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニ ル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカル 10 ボニル基又はフェニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 (C₁-C₈) アルキレン基、 (C₃-C₈)アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン 原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ 基、ハロ (C₁-C₆)アルコキシ基、 (C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆)ア ルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルス 15 ルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスル ホニル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ カルボニル基又はフェニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 (C3- C_8)アルケニレン基、 (C_3-C_8) アルキニレン基又は同一若しくは異なっても良 く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、 (C₁-20 C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハ $D(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)

又、前記(C_1 - C_8)アルキレン基、置換(C_1 - C_8)アルキレン基、(C_3 - C_8)アルケニレン基、置換(C_3 - C_8)アルケニレン基、(C_3 - C_8)アルキニレン基又は置換(C_3 - C_8)アルキニレン基中の任意の飽和炭素原子は(C_2 - C_5)アルキレン基で置換されて(C_3 - C_6)シクロアルカン環を示すこともでき、前記(C_1 - C_8)

 C_6)アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)

C₆)アルコキシカルボニル基又はフェニル基から選択される1以上の置換基を有

アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6)

アルキレン基、置換 (C_1-C_8) アルキレン基、 (C_3-C_8) アルケニレン基、置換 (C_3-C_8) アルケニレン基中の任意の 2 個の炭素原子はアルキレン基又はアルケニレン基と一緒になって (C_3-C_6) シクロアルカン環又は (C_3-C_6) シクロアルケン環を示すこともできる。

Bが-CO-又は-C($=N-OR^4$)-(式中、 R^4 は水素原子、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ(C_1-C_6)アルキル基、(C_3-C_6)アルケニル基、ハロ(C_3-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、フェニル(C_1-C_4)アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ(C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルキン基、ハロ(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ(C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1-C_6)アルキルアミノ基又は(C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から 選択される 1以上の置換基を環上に有する置換フェニル(C_1-C_4)アルキル基を示す。)を示す。

 R^1 が水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、ハロ (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、コーンは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシストカンボニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルカンガーによる。 (C_1-C_6) アルキルスルカンガーによる。 (C_1-C_6) アルキルスルカンガーによる。 (C_1-C_6) アルキルスルカンガーによる。 (C_1-C_6) アルキルスルカンガーによる。 (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても

良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) C_6)アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフ ィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、 (C₁-C₆)アルキルスルホ 5 ニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ 基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アル コキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル アミノ基、フェニルオキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ 基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) ア 10 ルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) ア ルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良 いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選 15 択される1以上の置換基を有する置換フェニルオキシ基、フェニルチオ基、同一 又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C₁-C₆)アルキル 基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁-C₆)アルコ キシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) 20 アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シ アノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハ ロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) C_6)アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても 良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から

選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。又、 R^1 は A^1 と結合して、 $1\sim2$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $4\sim7$ 員環を形成することができる。

 R^2 及び R^3 が同一又は異なっても良く、水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基を 5 示し、

 $Q^1 \sim Q^4$ が同一又は異なっても良く、X(Xは後記に示す。)で置換されても良い炭素原子を示し、Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6)アルケニル基、ハロ (C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルケニル基、ハロ (C_2-C_6) アルケニル基、ハロ (C_2-C_6) アルカニル 基、ハロ (C_1-C_6) アルカニルを示す。又、 方香環上の隣接した 2 個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルチオースルカニルを示す。 スルフィニルを、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニルを、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニルを、 (C_1-C_6) アルキルスルカーに表がら選択される 1 以上の置換基を有することもできる。

 Q^5 が窒素原子又は炭素原子を示し、Yが同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $(C_1 - C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル基、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ 20 基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルカーには、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルカーには、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルカーには、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルカーには、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルカーには、ハロ

ル基又はハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、ピリジルオキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基 又はハロ(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジルオキシ基を示す。

又、芳香環上の隣接した2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルカロ (C_1-C_6) アルキルスルカロ (C_1-C_6) アルキルスルカロ (C_1-C_6) アルキルスルカロ (C_1-C_6) アルキルスルカロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基から選択される1以上の置換基を有することもでき、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有することもでき、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル

 Z^{1} 及び Z^{2} は酸素原子を示す請求項2記載の芳香族ジアミド誘導体又はその 塩類。

- 20 4. 請求項1~3いずれか1項記載の芳香族ジアミド誘導体又はその塩類を 有効成分として含有することを特徴とする農園芸用薬剤。
 - 5. 農園芸用薬剤が殺虫剤である請求項4記載の農園芸用薬剤。
- 6. 有用植物から害虫を防除するために請求項4又は5記載の農園芸用薬剤の有効量を対象作物植物体又は土壌に処理することを特徴とする農園芸用薬剤の 25 使用方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP00/06514

	·	<u></u>				
Int.	EFICATION OF SUBJECT MATTER C1 C07C233/83, 237/22, 251/38 81, 213/82, 239/28, A01N37/22,	3, 317/28, 323/12, 323/4 37/50, 43/40	11, C07D213/75,			
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC						
B. FIELDS SEARCHED						
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl ⁷ C07C233/83, 237/22, 251/38, 317/28, 323/12, 323/41, C07D213/75, 213/81, 213/82, 239/28, A01N37/22, 37/50, 43/40						
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched						
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CAPLUS (STN), REGISTRY (STN)						
C. DOCUI	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT					
Category*	Citation of document, with indication, where ap	<u>,</u>	Relevant to claim No.			
x	EP, 919542, A2 (NIHON NOHYAKU CO2 June, 1999 (02.06.99), Claims; Compound Nos.1973-1987 & CZ, 9803799, A3 & AU, 98933 & ZA, 9810677, A & HU, 98023 & CN, 1222506, A & JP, 11-24 & BR, 9805060, A & KR, 99045 & BR, 9805060, A & KR, 99045 & CD, 1997 (08.10.97), Claims; Compound No.41 & JP, 9-323974, A & CA, 22014 & KR, 97069989, A & BR, 97010 & US, 5843868, A & KR, 99005 & TW, 366261, A & VATULINA, G. G. et al., "Search a series of glutamic derivative KhimFarm. Zh., 1986, Vol.20, p.1078 Compound VIII	292, A 725, A2 40857, A 5504, A 30., LTD.), 437, A 512, A 8488, A	1-6			
Further	r documents are listed in the continuation of Box C.	See patent family annex.				
date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		priority date and not in conflict with the understand the principle or theory understand the principle or theory understand the principle or theory understand the considered novel or cannot be considered step when the document is taken alone document of particular relevance; the considered to involve an inventive step combined with one or more other such combination being obvious to a person document member of the same patent if	priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art			
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office		Authorized officer				
Facsimile No		Telenhone No.				

					
A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC)) Int. Cl. [†] C07C233/83, 237/22, 251/38, 317/28, 323/12, 323/41, C07D213/75, 213/81, 213/82, 239/28, A01N37/22, 37/50, 43/40					
R 調本たり	テった分野				
B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC)) Int. Cl. ¹ CO7C233/83, 237/22, 251/38, 317/28, 323/12, 323/41, CO7D213/75, 213/81, 213/82, 239/28, A01N37/22, 37/50, 43/40					
最小限資料以外	トの資料で調査を行った分野に含まれるもの				
国際調本ではF	日)を爾子データベース(データベースの夕毎	調杏に使用した用語)			
国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語) CAPLUS (STN) , REGISTRY (STN)					
C. 関連する	ると認められる文献	,			
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連すると	こきは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号		
Х	EP, 919542, A2 (NIHON NOHYAKU CO., LT 特許請求の範囲, 化合物No. 1973-1987 &CZ, 9803799, A3 &AU, 9893292, A &Z &CN, 1222506, A &JP, 11-240857, A &B	A, 9810677, A &HU, 9802725, A2	1-6		
х	EP, 799825, A1 (NIHON NOHYAKU CO., LT特許請求の範囲, 化合物No. 41 &JP, 9-323974, A &CA, 2201437, A &KR &US, 5843868, A &KR, 99008488, A &TW	R, 97069989, A &BR, 9701612, A	1-4		
▼ C欄の続きにも文献が列挙されている。 □ パテントファミリーに関する別紙を参照。			紙を参照。		
* 引用文献のカテゴリー 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」国際出願目前の出願または特許であるが、国際出願日 以後に公表された文献であっ出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理の理解のために引用するもの「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発いた。日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す) 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願 「を見からないと考えられるもの」「A」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発の新規性又は進歩性がないと考えられるもの「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1上の文献との、当業者にとって自明である組合せよって進歩性がないと考えられるもの「&」同一パテントファミリー文献			発明の原理又は理論 当該文献のみで発明 たられるもの 当該文献と他の1以 自明である組合せに		
国際調査を完了した日 24.10.00		国際調査報告の発送日 . 07.1	1.00		
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁(ISA/JP)		特許庁審査官(権限のある職員) 爾見 武志	4H 9547		
郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号		電話番号 03-3581-1101	/ 内線 3443		

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP00/06514

C (続き) 川用文献の カテゴリー*	関連すると認められる文献 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Х		
	·	
•		
,		
:		,
,		

This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

BLACK BORDERS

IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES

FADED TEXT OR DRAWING

BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING

SKEWED/SLANTED IMAGES

COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS

GRAY SCALE DOCUMENTS

LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT

REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

☐ OTHER:

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.